

Europäisches Patentamt European Patent Office Office européen des brevets



① Veröffentlichungsnummer: 0 419 944 A2

(12)

EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

(21) Anmeldenummer: 90117567.9

(1) Int. Cl.5: C07D 263/34, C07D 277/56, A01N 43/76, A01N 43/78

Anmeldetag: 12.09.90

3 Priorität: 26.09.89 DE 3932052

Veröffentlichungstag der Anmeldung: 03.04.91 Patentblatt 91/14

(84) Benannte Vertragsstaaten: BE CH DE ES FR GB IT LI NL

71 Anmelder: BASF Aktiengesellschaft Carl-Bosch-Strasse 38 W-6700 Ludwigshafen(DE)

② Erfinder: Ditrich, Klaus, Dr. Paray-le-Monial-Strasse 12 W-6702 Bad Duerkheim(DE) Erfinder: Maywald, Volker, Dr. Berner Weg 24

W-6700 Ludwigshafen(DE)

Erfinder: Hamprecht, Gerhard, Dr.

Rote-Turm-Strasse 28 W-6940 Weinheim(DE)

Erfinder: Harreus, Albrecht, Dr.

Teichgasse 13

W-6700 Ludwigshafen(DE)

Erfinder: Wuerzer, Bruno, Dr.

Ruedigerstrasse 13 W-6701 Otterstadt(DE)

Erfinder: Westphalen, Kari-Otto, Dr.

Mausbergweg 58 W-6720 Speyer(DE)

(S) Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide.

Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide der Formeln la und lb

Ib

in denen die Substituenten folgende Bedeutung haben:

X Sauerstoff oder Schwefel;

R¹ Wasserstoff; Halogen; gegebenenfalls substituiertes C₁-C₅-Alkyl, Benzyl, Cycloalkyl, Alkenyl, Alkinyl, Phenyl, Phenoxy oder Phenylthio; Alkoxy; Alkylthio; Halogenalkoxy; Halogenalkylthio; oder einen gegebenenfalls substituierten 5- bis 6-gliedrigen heterocyclischen Rest;

R² Formyl, 4,5-Dihydrooxazol-2-yl oder den Rest -COYR⁵;

Y Sauerstoff oder Schwefel;

R⁵ Wasserstoff; Cycloalkyl; gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Phenyl, Benzyl, Alkenyl, Cycloalkenyl oder

einen gegebenenfalls substituierten 5- oder 6-gliedrigen heterocyclischen Rest; Phthalimido; Tetrahydrophthalimido; Succinimido; Maleinimido;

ein Äquivalent eines Kations;

oder

einen Rest -N = CR6R7;

R⁶, R⁷ Wasserstoff; Alkyl; Cycloalkyl; Phenyl; Furyl oder zusammen eine Methylenkette mit 4 bis 7 Kettengliedem;

R³ Wasserstoff oder gegebenenfalls substituiertes Alkyl oder Cycloalkyl; R⁴ Hydroxy; Alkoxy;

gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Alkenyl, Alkinyl, Phenyl oder Naphthyl;

einen gegebenenfalls substituierten 5- bis 6-gliedrigen heterocyclischen Rest; oder R³ und R⁴ gemeinsam einen Rest der Struktur -(CH₂)_n-Y_p-(CH₂)_q-, wobei n und q 1, 2 oder 3, p 0 oder 1 und Y Sauerstoff, Schwefel oder N-Methyl bedeuten oder den Rest der Formel -(CH₂)₃-CO- bilden, sowie deren umweltverträgliche Salze,

wobei in der Formel Ib X nicht Schwefel bedeutet, wenn R¹ 3-Pyridyl, R² CO₂CH₂CH₃ oder R³ Wasserstoff bedeutet, und wobei in der Formel la X nicht Schwefel oder R¹ nicht Thien-2-yl bedeutet, wenn YR⁵ für OH steht und R³ Wasserstoff und R⁴ Methyl bedeutet, Verfahren zur Herstellung und herbizide Mittel, die die Verbindungen der Formeln la oder Ib als Wirkstoffe enthalten.

OXAZOL- BZW. THIAZOLCARBONSÄUREAMIDE

Die vorliegende Erfindung betrifft Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide der Formeln la und lb

10

5

in denen die Substituenten folgende Bedeutung haben:

X Sauerstoff oder Schwefel;

R¹ Wasserstoff; Halogen; C1-C6-Alkyl, welches ein bis fünf Halogenatome und/oder einen oder zwei der folgenden Reste tragen kann: C3-C5-Cycloalkyl, C1-C4-Alkoxy, C1-C4-Halogenalkoxy, C1-C4-Alkyithio, C1-

C4-Halogenalkylthio oder Cyano;

Benzyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: C1-C4-Alkyl, C1-C4-Halogenalkyl, C1-C4-Alkoxy, C1-C4-Halogenalkoxy, C1-C4-Alkylthio, C1-C4-Halogenalkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro;

C₃-C₈-Cycloalkyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: C₁-C₄-Alkyl oder Halogen;

C2-C6-Alkenyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen, C1-C3-Alkoxy und/oder ein 20 Phenyl, das seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C1-C4-Alkyl, C1-C4-Halogenalkyl, C1-C4-Alkoxy, C1-C4-Halogenalkoxy, C1-C4-Alkylthio, C1-C4-Halogenalkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro; C2-C5-Alkinyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen oder C1-C3-Alkoxy und/oder ein Phenyl, das seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C1-C4-Alkyl, C1-C4-Halogenalkyl, C1-C4-Alkoxy, C1-C4-Halogenalkoxy, C1-C4-Alkylthio, C1-C4-Halogenalkylthio, Halogen, Cyano

oder Nitro; $C_1\text{-}C_4\text{-}Alkoxy; \ C_1\text{-}C_4\text{-}Alkylthio; \ C_1\text{-}C_4\text{-}Halogenalkoxy; \ C_1\text{-}C_4\text{-}Halogenalkylthio;}$ Phenoxy oder Phenylthio, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: C1-C4-Alkyl, C1-C4-Halogenalkyl, C1-C4-Alkoxy, C1-C4-Halogenalkoxy, C1-C4-Alkylthio, C1-C4-Halogenalkylthio, Halogen, Cyano

ein 5- bis 6-gliedriger heterocyclischer Rest, enthaltend ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff, wobei der Ring ein oder zwei der folgenden Reste tragen kann: C1-C3-Alkyl, Halogen, C1-C3-Alkoxy oder C1-C3-Alkoxycarbonyl;

Phenyl, welches eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C1-C6-Alkyl, C1-C6-Halogenalkyl, C1-C6-Alkoxy, C1-C6-Halogenalkoxy, C1-C6-Alkylthio, C1-C6-Halogenalkylthio, Halogen, Nitro und Cyano,

R² Formyl, 4,5-Dihydrooxazol-2-yl oder den Rest -COYR⁵;

Y Sauerstoff oder Schwefel;

C₁-C₆-Alkyl, welches ein bis fünf Halogenatome oder Hydroxygruppen und/oder einen der folgenden Reste tragen kann: C₁-C₄-Alkoxy, C₂-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkoxy, Cyano, Trimethylsilyi, C₁-C₃-Alkylthio, C₁-C₃-Alkylthio lamino, C₁-C₃-Dialkylamino, C₃-C₇-Cycloalkylamino, C₁-C₃-Alkylsulfinyl, C₁-C₃-Alkylsulfonyl, Carboxyl, C₁-C₃-Alkoxycarbonyl, C₁-C₃-Dialkylaminocarbonyl, C₁-C₃-Dialkoxyphosphonyl, Alkaniminoxy, Thienyl, Furyl, Tetrahydrofuryl, Phthalimido, Pyridyl, Benzyloxy, Benzoyl, wobei die cyclischen Reste ihrerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy oder Halogen;

Benzyl, das eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C1-C3-Alkyl, C1-C3-Alkoxy, C1-C3-Halogenal-

kyl, Halogen, Nitro und Cyano;

C3-C8-Cycloalkyl;

Phenyl, das eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C1-C4-Alkyl, C1-C4-Alkoxy, C1-C4-Halogenalkyl, C1-C4-Halogenalkoxy, C1-C4-Alkoxycarbonyl, Halogen, Nitro und Cyano;

C₃-C₈-Alkenyl, C₅-C₆-Cycloalkenyl oder C₃-C₈-Alkinyl, wobei diese Reste eine der folgenden Gruppen tragen können: Hydroxy, C1-C4-Alkoxy, Halogen oder einen Phenylring, welcher seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C1-C4-Alkyl, C1-C4-Alkoxy, C1-C4-Halogenalkyl, Halogen, Nitro und

einen fünf- bis sechsgliedrigen heterocyclischen Rest enthaltend ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff oder einen Benzotriazolrest;

Phthalimido; Tetrahydrophthalimido; Succinimido; Maleinimido;

ein Äquivalent eines Kations aus der Gruppe der Alkali- oder Erdalkalimetalle, Mangan, Kupfer, Eisen, Ammonium und substituiertes Ammonium;

einen Rest -N = CR6R7;

- R⁶, R⁷ Wasserstoff; C₁-C₄-Alkyl; C₃-C₆-Cycloalkyl; Phenyl oder Furyl oder zusammen eine Methylenkette der Formel - $(CH_2)_m$ - mit m = 4 bis 7 Kettengliedern;
 - R³ Wasserstoff; C1-C6-Alkyl, das einen bls drei der folgenden Substituenten tragen kann: Hydroxy, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio oder Di-C₁-C₃-Alkylamino;
 - C3-C8-Cycloalkyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: C1-C4-Alkyl, Halogen und C1-C4-Halogenalkyl;

R4 Hydroxy; C1-C4-Alkoxy;

- C1-C6-Alkyl, das eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C1-C4-Alkoxy, C1-C4-Halogenalkoxy, C1-C4-Alkylthio, C1-C4-Halogenalkylthio, C1-C4-Dialkylamino, Halogen, C3-C8-Cycloalkyl oder Phenyl, welches seinerseits ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen, Cyano, Nitro, C1-C4-Alkyl, C1-C4-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio oder C₁-C₄-Halogenalkylthio;
- C3-C8-Cycloalkyl, das eine bis drei der folgenden Grupen tragen kann: C1-C6-Alkyl, C1-C6-Halogenalkyl, C1-C4-Alkoxy, C1-C4-Halogenalkoxy, Halogen, Nitro oder Cyano;
- C₃-C₆-Alkenyl oder C₃-C₆-Alkinyl, das ein- bis dreimal durch Halogen und/oder einmal durch Phenyl substituiert sein kann, wobei der Phenylring seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann:
- C1-C4-Alkyl, C1-C4-Halogenalkyl, C1-C4-Alkoxy, C1-C4-Halogenalkoxy, C1-C4-Alkylthio, C1-C4-Halogenalkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro;
 - ein 5- bis 6-gliedriger heterocyclischer Rest enthaltend ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel oder Stickstoff, welcher ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: C1-C4-Alkyl oder Halogen;
- 25 Phenyl, das eine bis vier der folgenden Gruppen tragen kann: C1-C4-Alkyl, C1-C4-Halogenalkyl, C1-C4-Alkoxy, C1-C4-Halogenalkoxy, C1-C4-Alkylthio, C1-C4-Halogenalkylthio, Halogen, Nitro, Cyano, Formyl, C1-C4-Alkanoyi, C1-C4-Halogenalkanoyi oder C1-C4-Alkoxycarbonyi;

Naphthyl, das ein- bis dreimal durch C1-C4-Alkyl oder Halogen substituiert sein kann,

oder

- R³ und R⁴ gemeinsam einen Rest der Struktur -(CH₂)_n-Y_p-(CH₂)_q-, wobei n und q 1, 2 oder 3, p 0 oder 1 und Y Sauerstoff, Schwefel oder N-Methyl bedeuten oder den Rest der Formel -(CH2)3-CO- bilden, sowie deren umweltverträgliche Salze,
 - wobei in der Formel Ib X nicht Schwefel bedeutet, wenn R¹ 3-Pyridyl, R² CO₂CH₂CH₃ oder R³ Wasserstoff bedeutet und wobei in der Formel la X nicht Schwefel und R1 nicht Thien-2-yl bedeutet, wenn YR5 für OH steht und R³ Wasserstoff und R⁴ Methyl bedeutet.

Weiterhin betrifft die Erfindung Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, sowie herbizide Mittel, welche mindestens eine Verbindung la oder lb enthalten, in denen die Substituenten die vorstehend gegebene Bedeutung haben und X Schwefel bedeuten kann, wenn R1 3-Pyridyl, R2 CO2CH2CH3 und R2 Wasserstoff bedeutet, oder wenn R1 Thien-2-yl, YR5 Hydroxy, R3 Wasserstoff und R4 Methyl bedeutet.

Oxazol- und Thiazolcarbonsäuren bzw. deren Derivate sind bekannt (DE-A 22 54 944, Bull. Soc. Chim. Fr., 1969, 2152 sowie DE-A 22 21 647). Mögliche Anwendungen dieser Substanzen als herbizide Mittel sind nicht beschrieben.

Aufgabe der vorliegenden Erfindung war es, neue herbizid wirksame Verbindungen zu finden und zu synthetisieren.

Demgemäß wurden die eingangs definierten Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide la und Ib gefun-

Außerdem wurden Verfahren zu ihrer Herstellung gefunden und herbizide Mittel, welche Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide la und lb enthalten, in denen die Substituenten vorstehend gegebene Bedeutung haben.

Die erfindungsgemäßen Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide la und lb sind auf verschiedenen Wegen herstellbar. Man erhält sie beispielsweise nach den folgenden Verfahren:

1. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und lb, in denen R² CO₂R⁵ und R⁵ C₁-C₆-Alkyl bedeutet

45

50

$$R^{1} \xrightarrow{X} CO_{2}R^{5}$$

$$Ia \qquad Ib$$

$$(R^{5} = C_{1}-C_{6}-Alkyl)$$

Man erhält diese Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide la und Ib dadurch, daß man einen Diester der Formel II in an sich bekannter Weise mit einem Äquivalent einer wäßrigen Base zum Monoester Illa bzw. Illb hydrolysiert und Illa und Illb danach getrennt oder im Gemisch zunächst in das Halogenid oder eine andere aktivierte Form der Carbonsäure überführt und diese Derivate anschließend mit einem Amin IV amidiert.

20

R1

$$OR5$$
 $R1$
 $OR5$
 $OR5$

Die einzelnen Reaktionsschritte A und B dieser Synthesesequenz können wie folgt durchgeführt werden:

Reaktionsschritt A:

35

55

5

10

Die partielle Verseifung des Diesters II zum Monoester Va und Vb wird üblicherweise bei Temperaturen von -20 bis 60°C, vorzugswelse -10 bis 30°C, in einem inerten, mit Wasser mischbaren organischen Lösungsmittel in Gegenwart von 1,0 bis 1,2 mol-äq. einer Base durchgeführt.

Als Basen eignen sich insbesondere Hydroxyde von Alkalimetall-Kationen. Die Base wird im allgemeinen als 5 bis 20 %ige wäßrige Lösung zugesetzt.

Bevorzugte Lösungsmittel für diese Umsetzung sind beispielsweise Dioxan oder der der Esterkomponente in der Formel II entsprechende Alkohol.

Zur Aufarbeitung wird das Reaktionsgemisch üblicherweise angesäuert, wobei sich das gewünschte Produkt als Feststoff oder als ÖI abscheidet. Die Isolierung erfolgt in üblicher Weise durch Filtration bzw. Extraktion.

Das Gemisch der beiden isomeren Monoester IIIa und IIIb kann durch fraktionierte Kristallisation oder auf chromatographischem Wege getrennt werden oder es kann ohne Trennung weiter umgesetzt werden.

Reaktionsschritt B:

Man erhält die Verbindungen la bzw. Ib aus den Monoestern Illa und illb, in dem man Illa und Illb zunächst in an sich bekannter Weise in das Halogenid oder eine andere aktivierte Form der Carbonsäurefunktion überführt und diese Derivate anschließend mit einem Amin IV amidiert.

Aktivierte Formen der Carbonsäure sind neben Halogeniden wie insbesondere den Chloriden und den

Bromiden beispielsweise auch Imidazolide. Im allgemeinen werden die Halogenide bevorzugt.

Man erhält sie durch Umsetzung der Carbonsäuren Illa und Illb mit einem Halogenierungsmittel wie Thionylchlorid, Thionylbromid, Phosphoroxychlorid bzw. -bromid, Phosphortri- und -pentachlorid bzw. -bromid, Phosgen sowie elementarem Chlor und Brom.

Das Halogenierungsmittel wird in 1 bis 5 mol-äq., vorzugsweise 1 bis 2 mol.äq., eingesetzt.

Die Umsetzung verläuft bei Temperaturen von 0°C bis zum Siedepunkt des Halogenierungsmittels bzw. sofern man in Gegenwart eines inerten organischen Lösungsmittels arbeitet, auch dessen Siedepunkt, vorzugsweise 20 bis 120°C.

Als Lösungsmittel eignen sich beispielsweise Kohlenwasserstoffe und Halogenkohlenwasserstoffe wie Tetrachlorethan, Methylenchlorid, Chloroform, Dichlorethan, Chlorbenzol, 1,2-Dichlorbenzol, Benzol, Toluol und Xylol.

Üblicherweise werden die aktivierten Carbonsäurederivate isoliert, beispielsweise durch abdestillieren des Halogenierungsmittels und sofern vorhanden des Lösungsmittels und erst anschließend mit den Aminen IV umgesetzt.

In diesem Fall wird die Amidierung bei Temperaturen von -20 bis 100°C, vorzugsweise -10 bis 20°C in einem inerten aprotisch polaren organischen Lösungsmittel durchgeführt.

Für diese Umsetzung eignen sich insbesondere Halogenkohlenwasserstoffe wie Dichlormethan und Ether wie Diethylether und tert.-Butylmethylether als Lösungsmittel.

Da bei der Amidierung von Säurehalogeniden Halogenwasserstoff gebildet wird, empfiehlt es sich, das Amin IV in 2 bis 5 mol.-äq. Überschuß, vorzugsweise 2 bis 3 mol.-äq. zuzusetzen. Sofern das Amin in äquimolaren Mengen (1 bis 1,2 mol-äq.) eingesetzt wird, sollte zum Binden des Halogenwasserstoffs eine Base, insbesondere ein tertiäres Amin wie Triethylamin oder Pyridin zugegeben werden.

Sofern man von einem Gemisch der Monoester IIIa und IIIb ausgeht erhält man bei der Umsetzung ein Gemisch aus den Isomeren Carbonsäureamiden Ia und Ib. Dieses Gemisch kann auf herkömmliche Weise, beispielsweise durch fraktionierte Kristallisation oder Chromatographie in die Einzelkomponenten aufgetrennt werden.

Die für diese Synthesesequenz benötigten Edukte II sind bekannt (Bull. Soc. Chim. Fr. 1974, 2079) oder nach bekannten Methoden (Bull. Soc. Chim. Fr. 1969, 1762; J. Chem. Soc., 1953, 93) zugänglich.

2. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und lb, in denen X Schwefel und R² CO₂H bedeutet

30

35

50

Man erhält diese Thiazolcarbonsäureamide la und Ib besonders vorteilhaft, indem man ein Dicarbonsäureanhydrid der Formel V in an sich bekannter Weise mit einem Amin der Formel IV zu den Isomeren la und Ib umsetzt und anschließend das Gemisch in die Isomeren auftrennt.

Die Umsetzung wird üblicherweise bei Temperaturen von -10 bis 150°C, vorzugsweise 20 bis 120°C in einem inerten aprotisch polaren organischen Lösungsmittel durchgeführt.

Insbesondere kommen als Lösungsmittel Halogenkohlenwasserstoffe, z.B. Tetrachlorethan, Methylen-chlorid, Chloroform, Dichlorethan, Chlorbenzol und 1,2-Dichlorbenzol; Ether z.B. Diethylether, Methyl-tert.-butylether, Dimethoxyethan, Diethylenglykoldimethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan; dipolare aprotische Lösungsmittel, z.B. Acetonitril, Dimethylformamid, Dimethylacetamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, 1,3-Dimethyltetrahydro-2(1H)-pyrimidinon und 1,3-Dimethylimidazolidin-2-on; Aromate, z.B. Benzol, Toluol, Xylol, Pyridin und Chinolin; Ketone, z.B. Aceton, Methylethylketon oder entsprechende Gemische zur

Anwendung.

5

10

15

Das Amin IV wird im allgemeinen in äugimolaren Mengen oder im Überschuß, vorzugsweise in Mengen von 1,0 bis 5,0 mol-äq. bezogen auf V eingesetzt.

Die für dieses Verfahren benötigten Dicarbonsäureanhydride sind bekannt oder können nach bekannten Methoden hergestellt werden (Bull. Soc. Chim. Fr. 1969, 1762; CS-A-195 369; CS-A-195 370).

3. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und Ib in denen R¹ nicht Halogen und R² Carboxyl oder Formyl bedeutet

$$R^{1}$$
 R^{2}
 R^{2}
 R^{4}
 R^{2}
 R^{2}
 R^{3}
 R^{1}
 R^{2}
 R^{3}
 R^{2}
 R^{3}
 R^{4}
 R^{2}
 R^{2}
 R^{3}
 R^{4}
 R^{2}
 R^{2}
 R^{3}
 R^{4}

Man erhält diese isomeren Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide, indem man eine Carbonsäure IIIc bzw. IIId gemäß den unter 1 B geschilderten Bedingungen aktiviert und amidiert und die so erhaltenen Amide Vla und Vlb anschließend in an sich bekannter Weise in Gegenwart eines Carboxylierungs-oder Formylierungsreagens' umsetzt.

Der Reaktionsschritt A. dieser Synthesesequenz wird im allgemeinen und im besonderen entsprechend den im Verfahren 1 unter Punkt B beschriebenen Bedingungen durchgeführt.

Reaktionsschritt B.

40

50

Die Carboxylierung bzw. Formylierung der Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide VIa bzw. VIb erfolgt in der Regel bei Temperaturen von 0 bis -100°C, vorzugsweise -50 bis -80°C in einem aprotisch polaren inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base unter Ausschluß von Feuchtigkeit.

Bevorzugtes Carboxylierungsreagens ist gasförmiges oder festes Kohlendioxid, als Formylierungsreagens dient insbesondere Dimethylformamid und N-Formylmorpholin.

Geeignete Lösungsmittel sind insbesondere Ether, z.B. Diethylether, Methyl-tert.-butylether, Dimethoxyethan, Diethylenglykoldimethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan.

Als Basen finden bevorzugt Organometallverbindungen Methyllithium, n-Butyllithium, s-Butyllithium, t-Butyllithium oder Phenyllithium Verwendung.

Die Umsetzung wird üblicherweise so durchgeführt, daß zunächst eine Lösung des Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamids VIa bzw. VIb mit bis 3 mol-äq der gelösten Base versetzt wird, wobei ein am Heterocyclus metalliertes Derivat entsteht, welches bei der anschließenden Zugabe des elektrophilen Carboxylierungs- bzw. Formylierungsreagens' zum gewünschten Produkt la bzw. Ib abreagiert.

Sofern R³ Wasserstoff bedeutet werden entsprechend mehr mol-äq, der Base benötigt, da in diesem Fall zunächst der Amid-Stickstoff deprotoniert wird. Vorzugsweise verwendet man daher bei der Umetzung von Carbonsäureamiden VIa bzw. VIb, in denen R³ Wasserstoff bedeutet 2 bis 2,5 mol-äq der Base.

Verbindungen VIa bzw. VIb, in denen R¹ Wasserstoff bedeutet werden bei der Umsetzung mit der Base zunächst in 2-Position des Heterocyclus' metalliert.

Um in diesem Fall den Carboxyl- bzw. Formylrest in Nachbarstellung zur Amidgruppe einzuführen ist es notwendig, von Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamiden Vla bis Vlb auszugehen, in denen R³ Wasserstoff bedeutet.

Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide la bzw. Ib in denen R¹ Wasserstoff und R³ nicht Wasserstoff bedeutet erhält man aus den nach dem vorstehenden Verfahren zugänglichen Verbindungen, in denen R¹ und R³ Wasserstoff bedeutet, in an sich bekannter Weise durch nachträgliche Alkylierung oder Cycloalkylierung.

Die für das vorstehende Verfahren benötigten Carbonsäuren Illc und Illd sind literaturbekannt Beilstein, (Band 27, 1.-5. Erg.Werte) oder sie können nach bekannten Methoden, beispielsweise durch Oxidation der entsprechenden Alkohole oder Aldehyde oder durch Hydrolyse der entsprechenden Nitrile hergestellt werden (J.V. Metzger in "The Chemistry of Heterocyclic Compounds, Vol. 34, Part 1, Thiazol and its Derivatives", Arnold Weissberger and E.D. Ward C. Taylor (Editors), John Wiley and Sons, S. 519 ff, I.J. Turchi in "The Chemistry of Heterocyclic Compounds, Vol. 45, Oxazoles", Arnold Weissberger and E.D. Ward, C. Taylor (Editors), John Wiley and Sons).

4. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und lb, in denen R2 Carboxyl bedeutet.

Man erhält diese Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide la und lb beispielsweise dadurch, daß man ein entsprechendes Carbonsäureamid la bzw. lb, in dem R² für CO2R⁵ und R⁵ für C1-C6-Alkyl steht in an sich bekannter Weise mit einem Äquivalent einer wäßrigen Base hydrolysiert. Die Umsetzung ist im folgenden Schema lediglich für die Carbonsäureamide la gezeigt. Sofern man von den entsprechenden Carbonsäureamiden lb ausgeht verläuft sie analog.

Diese Synthese wird im aligemeinen und im besonderen entsprechend den im Verfahren 1 unter Punkt

A beschriebenen Bedingungen durchgeführt.

5. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und lb, in denen R2 COYR5 bedeutet:

Man erhält diese Carbonsäureamide la und lb, in dem man eine entsprechende Carbonsäure la bzw. lb (R² = CO₂H) aktiviert und anschließend in an sich bekannter Weise mit einer Verbindung VII umsetzt.

10

20

25

35

20

30

35

40

45

50

55

Die Umsetzung kann bei Temperaturen von -20°C bis zur Rückflußtemperatur des Lösungsmittels bzw. -gemisches, vorzugsweise bei 0 bis 60°C durchgeführt werden.

Zweckmäßigerweise verwendet man für diese Umsetzungen Lösungsmittel wie Halogenkohlenwasserstoffe, z.B. Tetrachlorethan, Methylenchlorid, Chloroform, Dichlorethan, Chlorbenzol und 1,2-Dichlorbenzol; Ether z.B. Diethylether, Methyl-tert.-butylether, Dimethoxiethan, Diethylenglykoldimethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan; Aromaten z.B. Benzol, Toluol oder Xylol; oder entsprechende Gemische.

Als wasserentziehende Mittel kommen Dicyclohexylcarbodiimid oder Propanphosphonsäureanhydrid in

Die molaren Verhältnisse, in denen die benötigten Ausgangsverbindungen miteinander umgesetzt werden, betragen im allgemeinen 0,5:1 bis 2:1 für das Verhältnis von Carbonsäure IVa zu Alkohol oder Thiol und 1:1 bis 1:3 für das Verhältnis von Carbonsäure IVa zu wasserentziehendem Mittel.

Die Konzentration der Edukte im Lösungsmittel beträgt im allgemeinen 0,1 bis 5 mol/l, bevorzugt 0,2 bis 2 mol/l.

Besonders bevorzugt arbeitet man in Ethern wie Diethylether, Tetrahydrofuran oder Dioxan; mit Propanphosphonsäureanhydrid als wasserentziehendem Mittel bei 20 bis 60°C.

6. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und lb, in der R² eine 4,5-Dihydro-oxazol-2-yl-gruppe bedeutet

Man erhält diese Verbindungen dadurch, daß man ein entsprechendes Carbonsäurederivat la bzw. lb, in dem R² eine Gruppe CO₂R′ oder COOH und R′ C₁-C₄-Alkyl bedeutet, in an sich bekannter Weise mit einem Aminoalkohol der Formel VIII umsetzt.

Die Reaktion wird so durchgeführt, daß man die Verbindungen bei 0 bis 180°C, vorzugsweise bei Rückflußtemperatur des verwendeten Gemisches mit einem Aminoalkohol VIII, gegebenenfalls in Gegenwart eines inerten Lösungsmittels umsetzt. Ester oder Carbonsäure la bzw. Ib und Aminoalkohol VIII werden dabei im Verhältnis 1:1 bis 1:2,5, vorzugsweise 1:1 bis 1:1,5 eingesetzt.

Als Lösungsmittel verwendet man zweckmäßigerweise Halogenkohlenwasserstoffe wie Chlorbenzol und 1,2-Dichlorbenzol, Ether, z.B. Methyl-tert.-butylether, 1,2-Dimethoxyethan, Diethylenglykol-dimethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan; Alkohole wie Methanol, Ethanol, Propanol oder Ethylenglykol, dipolare aprotische Lösungsmittel, z.B. Acetonitril, Dimethylformamid, Dimethylacetamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, 1,3-Dimethyltetrahydro-2(1H)-pyrimidinon und 1,3-Dimethylimidazolin-2-on oder Aromaten, z.B. Benzol, Toluol und Xylol. Die Konzentration der Edukte im Lösungsmittel beträgt im allgemeinen 0,1 bis 5,0 mol/l, bevorzugt 0,2 bis 2,0 mol/l.

Die Umsetzung ist im allgemeinen nach 14 Stunden beendet; die Carbonsäureamide la und Ib werden dann gegebenenfalls durch Zugabe von Wasser ausgefällt, abgesaugt oder mit einem organischen Lösungsmittel extrahiert und mit üblichen Standardmethoden wie Umkristallisation oder Chromatographie gereinigt.

Man erhält die Verbindungen der Formel VIa, in denen R¹ einen Alkohol oder Thiolrest -ZR8 bedeutet, in an sich bekannter Weise (Helv. Chim. Acta, 37, 2059 (1954)) durch Umsetzung eines 2-Halogen-thiazol-4-carbonsäureamids VIa (DE 22 41 035) in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base mit einem Alkohol oder Thiol.

Hal
$$X$$
 H R^4 + H-ZR8 Base R^8Z X H R^4 YIa' YIa'

40

45

Hal in Formel VIa bedeutet dabei ein Halogenatom wie Fluor, Chlor, Brom und lod; insbesondere eignen sich Verbindungen VIa, in denen Hal, Chlor oder Brom bedeutet.

R¹ in Formel Vla´ bedeutet C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, die bis zu dreimal mit Halogen substituiert sein können, insbesondere Methoxy, Ethoxy, 1-Methyl-ethoxy, 1,1-Dimethylethoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, Difluormethylthio; oder Phenoxy oder Phenylthio, die bis zu dreimal durch C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro substituiert sein können, insbesondere 2,4-Dichlorphenoxy, 2,4-Difluorphenoxy, 2,4,6-Trifluorphenoxy, p-Trifluormethylphenoxy, 2-Chlor-4-Trifluorphenoxy, 3-Cyanophenoxy, 4-Cyano-2-methoxyphenoxy, 4-Nitrophenoxy, 2-Fluorthiophenyl, 4-Trifluormethylthiophenyl, 3-Cyanothiophenyl.

Zweckmäßigerweise verwendet man für diese Umsetzungen Lösungsmittel wie Halogenkohlenwasserstoffe, z.B. Tetrachlorethan, Methylenchlorid, Chloroform, Dichlorethan, Chlorbenzol und 1,2-Dichlorbenzol; Ether, z.B. Diethylether, Methyl-tert.-butylether, Dimethoxiethan, Diethylenglykoldimethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan; dipolare aprotische Lösungsmittel, z.B. Acetonitril, Dimethylformamid, Dimethylacetamld, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, 1,3-Dimethyltetrahydro-2(1H)-pyrimidinon und 1,3-

Dimethylimidazolidin-2-on; Aromaten, z.B. Benzol, Toluol, Xylol, Pyridin und Chinolin; Ketone, z.B. Aceton, Methylethylketon; Alkohole, z.B. Methanol, Ethanol, iso-Propanol und tert.-Butanol oder entsprechende Gemische.

Die Umsetzung kann bei Temperaturen von -100°C bis zur Rückflußtemperatur des jeweiligen Lösungsmittels bzw. -gemisches, vorzugsweise bei -60°C bis 150°C, durchgeführt werden.

Als Basen dienen Hydride und Alkoxide von Alkali- und Erdalkalimetallkationen, insbesondere NaH, KH, CaH₂, LiH und KO-t.-Bu. Mitunter ist es auch nützlich Kombinationen der oben angeführten Basen zu verwenden.

Die molaren Verhältnisse, in denen die benötigten Ausgangsverbindungen miteinander umgesetzt werden, betragen im allgemeinen 3:1 bis 1:1 für das Verhältnis von Alkohol oder Thiol zu 2-Halogen-thiazol-4-carbonsäureamid Vla und 1:1 bis 1:3 für das Verhältnis von Alkohol oder Thiol zur wirksamen Base.

Die Konzentration der Edukte im Lösungsmittel berägt im allgemeinen 0,1 bis 5 mol/l, bevorzugt 0,2 bis 2 mol/l.

Besonders bevorzugt arbeitet man in aprotisch dipolaren Solventien wie Acetonitril, Dimethylformamid,
Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, 1,3-Dimethyltetrahydro-2(1H)-pyrimidinon, 1,3-Dimethylimidazolidin-2on oder Ethern wie 1,2-Dimethoxiethan, Diethylenglykoldimethylether, Tetrahydrofuran oder Dioxan bei
Temperaturen zwischen 50°C und 150°C unter Verwendung von NaH oder KO-t.-Ba als Basen.

Die für die Umsetzung benötigten 2-Halogen-thiazol-4-carbonsäureamide der Formel IIIa können nach literaturbekannten Methoden aus den entsprechenden Carbonsäurehalogeniden durch Umsetzung mit Aminen gewonnen werden (DE-A 22 41 035).

Die zum Einsatz kommenden Alkohole oder Thiole sind in vielen Fällen kommerziell erhältlich oder können in an sich bekannter Weise hergestellt werden.

Des weiteren erhält man die Verbindungen der Formel VIb in an sich bekannter Weise (Helv. Chim. Acta, 37, 2059 (1954)) durch Umsetzung eines 2-Halogen-thiazol-5-carbonsäureamids IIIb in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base mit einem Alkohol oder Thiol gemäß Schema 2:

Hal
$$X \longrightarrow \mathbb{R}^3$$
 + H-Y-R8 $\longrightarrow \mathbb{R}^1$ $X \longrightarrow \mathbb{R}^3$ YID'

30

Hal in Formel VIb bedeutet dabei ein Halogenatom wie Fluor, Chlor, Brom und lod; insbesondere eignen sich Verbindungen VIb, in denen Hal, Chlor oder Brom bedeutet.

R¹ in Formel VIb bedeutet C1-C4-Alkoxy, C1-C4-Alkylthio, die bis zu dreimal mit Halogen substituiert sein können;

insbesondere Methoxy, Ethoxy, 1-Methyl-ethoxy, 1,1-Dimethylethoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, Difluormethylthio; oder Phenoxy oder Phenylthio, die bis zu dreimal durch C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro substituiert sein können; insbesondere 2,4-Dichlorphenoxy, 2,4-Difluorphenoxy, 2,4,6-Trifluorphenoxy, p-Trifluormethylphenoxy, 2-Chlor-4-Trifluorphenoxy, 3-Cyanophenoxy, 4-Cyano-2-methoxyphenoxy, 4-Nitrophenoxy, 2-Fluorthiophenyl, 4-Trifluormethylthiophenyl, 3-Cyanothiophenyl.

Zweckmäßigerweise verwendet man für diese Umsetzungen Lösungsmittel wie Halogenkohlenwasserstoffe, z.B. Tetrachlorethan, Methylenchlorid, Chloroform, Dichlorethan, Chlorbenzol und 1,2-Dichlorbenzol; Ether, z.B. Diethylether, Methyl-tert.-butylether, Dimethoxiethan, Diethylenglykoldimethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan; dipolare aprotische Lösungsmittel, z.B. Acetonitril, Dimethylformamid, Dimethylacetamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, 1,3-Dimethyltetrahydro-2(1H)-pyrimidinon und 1,3-Dimethylimidazolidin-2-on; Aromaten, z.B. Benzol, Toluol, Xylol, Pyridin und Chinolin; Ketone, z.B. Aceton, Methylethylketon; Alkohole, z.B. Methanol, Ethanol, iso-Propanol und tert.-Butanol oder entsprechende Gemische.

Die Umsetzung kann bei Temperaturen von -100°C bis zur Rückflußtemperatur des jeweiligen Lösungsmittels bzw. -gemisches, vorzugsweise bei -60°C bis 150°C, durchgeführt werden.

Als Basen dienen Hydride und Alkoxide von Alkali- und Erdalkalimetallkationen, insbesondere NaH, KH, CaH₂, LiH und KO-t.-Bu. Mitunter ist es auch nützlich Kombinationen der oben angeführten Basen zu verwenden.

Die molaren Verhältnisse, in denen die benötigten Ausgangsverbindungen miteinander umgesetzt werden, betragen im allgemeinen 3:1 bis 1:1 für das Verhältnis von Alkohol oder Thiol zu 2-Halogen-thiazol-

4-carbonsäureamid VIb und 1:1 bis 1:3 für das Verhältnis von Alkohol oder Thiol zur wirksamen Base.

Die Konzentration der Edukte im Lösungsmittel berägt im allgemeinen 0,1 bis 5 mol/l, bevorzugt 0,2 bis 2 mol/l.

Besonders bevorzugt arbeitet man in aprotisch dipolaren Solventien wie Acetonitril, Dimethylformamid, 5 Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, 1,3- Dimethyltetrahydro-2(1H)-pyrimidinon, 1,3-Dimethylimidazolidin-2-on oder Ethern wie 1,2-Dimethoxiethan, Diethylenglykoldimethylether, Tetrahydrofuran oder Dioxan bei Temperaturen zwischen 50°C und 150°C unter Verwendung von NaH oder KO-t.-Butylat als Basen.

Die für die Umsetzung benötigten 2-Halogen-thiazol-4-carbonsäureamide der Formel VIb können nach literaturbekannten Methoden aus den entsprechenden Carbonsäurehalogeniden durch Umsetzung mit Aminen gewonnen werden (US-A-4 001 421).

Verbindungen der Formel IVb können gewonnen werden, indem man Dicarbonsäureester der Formel XI in an sich bekannter Weise mit Aminen umsetzt und die resultierenden Amide IXb gemäß Schema G verseift:

II
$$\begin{array}{c}
 & \text{N} \\
 & \text{R}^3 \\
 & \text{R}^4
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
 & \text{N} \\
 & \text{R}^3 \\
 & \text{R}^4
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
 & \text{N} \\
 & \text{R}^3 \\
 & \text{R}^3
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
 & \text{N} \\
 & \text{R}^3
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
 & \text{N} \\
 & \text{R}^3
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
 & \text{R}^3 \\
 & \text{R}^3$$

$$\begin{array}{c}
 & \text{R}^3 \\
 & \text{R}^3
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
 & \text{R}^3 \\
 & \text{R}^3$$

$$\begin{array}{c}
 & \text{R}^3 \\
 & \text{R}^3
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
 & \text{R}^3 \\
 & \text{R}^3$$

$$\begin{array}{c}
 & \text{R}^3 \\
 & \text{R}^3
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
 & \text{R}^3 \\
 & \text{R}^3$$

Zweckmäßigerweise geht man dabei so vor, daß man den Diester II in einem inerten organischen Lösungsmittel löst und mit einem Amin umsetzt.

Als Lösungsmittel verwendet man für diese Umsetzungen Ether, z.B. Diethylether, Methyl-tert.-butylether, Dimethoxyethan, Diethylenglykoldimethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan; Aromaten, z.B. Benzol, Toluol, Xylol oder Mesitylen; Alkohole, z.B. Methanol, Ethanol, iso-Propanol und tert.-Butanol oder entsprechende Gemische.

Die Umsetzung kann bei Temperaturen von -100°C bis zur Rückflußtemperatur des jeweiligen Lösungsmittels bzw. -gemisches, vorzugsweise bei -60 °C bis 150 °C, durchgeführt werden.

Das molare Verhältnis, in dem Diester II und Amin eingesetzt werden, beträgt 1:1 bis 1:2, vorzugsweise 1:1 bis 1:1,2.

Die Konzentration der Edukte im Lösungsmittel beträgt im allgemeinen 0,1 bis 5 mol/l, bevorzugt 0,2 bis 2.0 mol/l.

Besonders bevorzugt arbeitet man in Alkoholen wie Ethanol in Gegenwart von einem Äquivalent Amin bei 50 bis 100°C. Die für die Umsetzung benötigten Diester XI, sind literaturbekannt oder können in Anlehnung an beschriebene Methoden hergestellt werden (Bull. Soc. Chim. Fr., 1969, 1762; J. Chem. Soc., 1953, 93).

Neben den vorstehend geschilderten Verfahren 1-7 zur Herstellung der Verbindungen la, Ib und Ic gibt es weitere Synthesemöglichkeiten, die den folgenden Literaturstellen zu entnehmen sind:

Beilstein, Hauptwerk sowie 1.-5. Erg.Werk, Band 27; R.W. Wiley, The Chemistry of Heterocyclic Compounds, Five- and Six-Membered Compounds with Nitrogen and Oxygen, Interscience Publishers, New York, London (1962), Heterocyclic Chemistry, Vol. 6, Five-membered Rings with Two or More Oxygen, Sulfur or Nitrogen Atoms, Pergamon Press, 1984, J. March, Advanced Organic Chemistry, Third Adition, John Wiley and Sons, 1985, Houben-Weyl, Methoden der organischen Chemie, 4. Auflage, Thieme Verlag, Bände IV, VI, VII, VIII, X.

Im Hinblick auf die bestimmungsgemäße Verwendung der Verbindungen la und lb kommen als Substituenten bevorzugt folgende Reste in Betracht:

X Sauerstoff oder Schwefel

R1 Wasserstoff;

30

40

Halogen wie Fluor, Chlor, Brom und lod, insbesondere Fluor und Chlor;

C1-C5-Alkyl, wie Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sek.-Butyl, iso-Butyl und tert.-Butyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 2,2-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl, insbesondere Methyl, Ethyl, Propyl und iso-Propyl, welches ein bis fünf Halogenatome, insbesondere Fluor-

und/ oder Chloratome oder einen oder zwei der folgenden Reste tragen kann: Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl, insbesondere Cyclopropyl; Alkoxy wie Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, 2-Methylethoxy, n-Butoxy, 1-Methylethoxy, 2-Methylpropoxy und 1,1-Dimethylethoxy, insbesondere Methoxy, Ethoxy, 1-Methylethoxy und 1,1-Dimethylethoxy; Halogenalkoxy wie Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Chlordifluormethoxy, Dichlorfluormethoxy, 1-Fluorethoxy, 2-Fluorethoxy, 2,2-Difluorethoxy, 1,1,2,2-Tetrafluorethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy, 2-Chlor-1,1,2-trifluorethoxy und Pentafluorethoxy, insbesondere Trifluormethoxy und Pentafluorethoxy; Alkylthio wie Methylthio, Ethylthio, Propylthio, 1-Methylethylthio, Butylthio, 1-Methylpropylthio, 2-Methylpropylthio und 1,1-Dimethylthio, insbesondere Methylthio und Ethylthio; Halogenalkylthio wie Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Chlordifluormethylthio, 1-Fluorethylthio, 2-Fluorethylthio, 2,2-Difluorethylthio, 2,2-Dichlor-2-fluorethylthio, 2,2-Trichlorethylthio und Pentafluorethylthio oder Cyano:

Benzyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Alkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und iso-Propyl; Halogenalkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethyl und Chlordifluormethyl; Alkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethoxy, Pentafluorethoxy und Trichlormethoxy; Alkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio; Halogenalkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Difluormethylthio, Pentafluorethylthio und Trifluormethylthio; Halogen wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor und Chlor; Cyano oder Nitro;

Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl und Cycloctyl, insbesondere Cyclopropyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Alkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Methyl oder Halogen wie vorstehend genannt, insbesondere Chlor und Fluor;

Alkenyl wie Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-butenyl, 3-Methyl-2-butenyl 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,1-Dimethyl-1-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl, 4-Methyl-1-pentenyl tenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Mehyl-3-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyi, 4-Methyi-3-pentenyi, 1-Methyi-4-pentenyi, 2-Methyi-4-pentenyi, 3-Methyi-4-pentenyi, 4-Methyi-4-pentenyi tenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-3-butenyl, 1,2-Dimethyl-1-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-3-butenyl, 1,2-Dimethyl, 1,2-Dimet Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-1-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-butenyl, 1,3-Dimethyl-3-butenyl, 2,2-Dimethyl-3butenyl, 2,3-Dimethyl-1-butenyl, 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 3,3-Dimethyl-1-butenyl, 1-Ethyl-1-butenyl, 1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-1-butenyl, 2-Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-2-propenyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-1-propenyl und 1-Ethyl-2methyl-2-propenyl, insbesondere Allyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen wie oben genannt, insbesondere Fluor und Chlor; Alkoxy wie obengenannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy. und/oder ein Phenyl, das seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Alkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und iso-Propyl; Halogenalkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethyl und Chlordifluormethyl; Alkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethoxy, Pentafluorethoxy und Trichlormethoxy; Alkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio; Halogenalkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Difluormethylthio, Pentafluorethylthio und Trifluormethylthio; Halogen wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor und Chlor, Cyano oder Nitro;

Alkinyl wie Ethinyl, 1-Propinyl, Propargyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Alkinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl, 1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-4-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl, insbesondere Propargyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen wie oben genannt, insbesondere lod; Alkoxy wie oben genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy, und/oder ein Phenyl, das seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Alkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und iso-Propyl; Halogenalkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethyl und Chlordifluormethyl; Alkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Methoxy wie vorstehend genannt, insbeson

dere Trifluormethoxy, Pentafluorethoxy und Trichlormethoxy; Alkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio; Halogenalkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Difluormethylthio, Pentafluorethylthio und Trifluormethylthio; Halogen wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor und Chlor, Cvano oder Nitro;

C1-C4-Alkoxy wie obenstehend genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy;

C₁-C₄-Halogenalkoxy wie obenstehend genannt, insbesondere Trifluormethoxy, Pentafluorethoxy und Trichlormethoxy;

C1-C4-Alkylthio wie obenstehend genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio;

C₁-C₄-Halogenalkytthio wie obenstehend genannt, insbesondere Difluormethylthio, Pentafluorethylthio und Trifluormethylthio;

Phenoxy oder Phenyithio, wobei diese Reste ein bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Alkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und iso-Propyl; Halogenalkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethyl und Chlordifluormethyl; Alkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethoxy, Pentafluorethoxy und Trichlormethoxy; Alkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio; Halogenalkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Difluormethylthio, Pentafluorethylthio und Trifluormethylthio; Halogen wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor und Chlor, Cyano oder Nitro;

ein 5- bis 6-gliedriger heterocyclischer Rest enthaltend ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff wie 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 4-Tetrahydropyranyl, 2-Tetrahydropyranyl, 3-Tetrahydropyranyl, 3-Furanyl, 2-Thienyl, 2-Furanyl, 3-Tetrahydrothienyl, 2-Tetrahydropyranyl, 5-Isoxazolyl, 3-Isoxazolyl, 4-Isoxazolyl, 5-Isothiazolyl, 4-Isothiazolyl, 3-Isothiazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Thiazolyl, 4-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 5-Oxazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, 5-Imidazolyl, 3-Pyrrolyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 4-Pyridyl, 3-Pyridyl und 2-Pyridyl, wobei dieser Ring ein oder zwei der folgenden Reste tragen kann: Alkyl wie oben genannt, insbesondere Methyl; Halogen wie oben genannt, insbesondere Fluor und Chlor; Alkoxy wie oben genannt, insbesondere Methoxy und Etoxy oder Alkoxycarbonyl wie Methoxycarbonyl und Ethoxycarbonyl, insbesondere Methoxycarbonyl; Phenyl, welches eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Alkyl wie bei R¹ genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und iso-Propyl; Halogenalkyl wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethyl und Chlordifluormethyl; Alkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Meth oxy und Ethoxy; Halogenalkoxy wie vorstehend genannt, insbesondere Trifluormethoxy, Pentafluorethoxy und Trichlormethoxy; Alkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio; Halogenalkylthio wie vorstehend genannt, insbesondere Difluormethylthio, Pentafluorethylthio und Trifluormethylthio; Halogen wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor und Chlor, Cyano oder Nitro;

R² Formyl, 4,5-Dihydroxazol-2-yl oder den Rest -COYR⁵

35 und

Y Sauerstoff oder Schwefel;

R⁵ Wasserstoff;

Alkyl, wie unter R¹ genannt, insbesondere Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl und n-Hexyl, welches ein bis fünf Halogenatome wie unter R¹ genannt, insbesondere Fluor und Chlor oder Hydroxygruppen und/oder einen der folgenden Reste tragen kann: Alkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Alkoxy-alkoxy wie Methoxy-ethoxy, Ethoxy-ethoxy, Propoxy-ethoxy, insbesondere Methoxy-ethoxy; Cyano; Trimethylsilyl; Alkylthio wie unter R1 genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio; Alkylamino wie Methylamino, Ethylamino, Propylamino, iso-Propylamino, insbesondere Methylamino und Ethylamino; Dialkylamino wie Dimethylamino, Diethylamino, Dipropylamino, Diisopropylamino, Methylethylamino, insbesondere Dimethylamino und Methylethylamino; Cycloalkylamino wie Cyclopropylamino, Cyclobutylamino, Cyclopentylamino, Cyclohexylamino und Cycloheptylamino, insbesondere Cyclopropylamino; Alkylsulfinyl wie Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Propylsulfinyl, iso-Propylsulfinyl, insbesondere Methylsulfinyl und Ethylsulfinyl; Alkylsulfonyl wie Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Propylsulfonyl, iso-Propylsulfonyl, insbesondere Methylsulfonyl und Ethylsulfonyl; Carboxyl; Alkoxycarbonyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxycarbonyl; Dialkylaminocarbonyl wie Dimethylaminocarbonyl, Diethylaminocarbonyl, Dipropylaminocarbonyl, Diisopropylaminocarbonyl, Dicyclopropylaminocarbonyl, Methylethylaminocarbonyl, insbesondere Dimethylaminocarbonyl und Diethylaminocarbonyl; Dialkoxyphosphonyl wie Dimethoxyphosphonyl, Diethoxyphosphonyl, Dipropoxyphosphonyl, Diisopropoxyphosphonyl, insbesondere Dimethoxyphosphonyl und Diethoxyphosphonyl; Alkaniminoxy wie insbesondere 2-Propaniminoxy; Thienyl, Furanyl, Tetrahydrofuranyl, Phthalimido, Pyridyl, Benzyloxy; Benzoyl, wobei die cyclischen Reste ihrerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: Alkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Methyl und Ethyl; Alkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy, oder Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Fluor und Chlor; Benzyl, das eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Alkyl wie unter R1 genannt, insbesondere

Methyl und Ethyl; Alkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethyl; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Fluor und Chlor, Nitro und Cyano;

C₃-C₈-Cycloalkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Cyclopentyl und Cyclohexyl;

- Phenyl, das eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Alkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Methyl und Ethyl; Alkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethyl; Halogenalkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethoxy; Alkoxycarbonyl wie vorstehend genannt, insbesondere Methoxycarbonyl; Halogen wie unter R1 genannt, insbesondere Fluor, Chlor und Brom, Nitro und Cyano;
- C₃-C₆-Alkenyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Allyl und Methallyl, C₅-C₆-Cycloalkenyl wie 2-Cyclopentenyl und 2-Cyclohexenyl, insbesondere 2-Cyclohexenyl oder C₃-C₆-Alkinyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Propargyl, wobei diese Reste eine der folgenden Gruppen tragen können: Hydroxy; Alkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere lod, oder Phenyl, welches seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Alkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Methyl und Ethyl; Alkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethyl; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Fluor
 - und Chlor, Nitro oder Cyano; einen fünf- bis sechsgliedrigen heterocyclischen Rest enthaltend ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff wie unter R1 genannt, insbesondere Tetrahydrofuranyl und Tetrahydropyranyl oder einen Benzotriazolrest;
 - Phthalimido; Tetrahydrophthalimido; Succinimido; Maleinimido;
 - ein Äquivalent eines Kations aus der Gruppe der Alkali- oder Erdalkalimetalle, Mangan, Kupfer, Eisen, Ammonium und substitulertes Ammonium
 - oder einen Rest -N = CR6R7, wobei R6 und R7 unabhängig voneinander Wasserstoff, Alkyl wie unter R1 genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und iso-Propyl; Cycloalkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Cyclopropyl; Phenyl oder Furyl bedeuten oder zusammen eine Methylenkette der Formel -(CH2)m- mit m = 4 bis 7 Kettengliedern,
 - R3 Wasserstoff,
 - C1-C6-Alkyl, wie unter R1 genannt, insbesondere Methyl, Ethyl, iso-Propyl, das einen bis drei der folgenden Substituenten tragen kann: Hydroxy; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Fluor und Chlor; Alkoxy wie unter R1 genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Alkylthio wie unter R1 genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio, oder Dialkylamino wie unter R⁵ genannt, insbesondere Dimethylamino; Cycloalkyl wie unter R1 genannt, insbesondere Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl,
 - welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Alkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und Isopropyl; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Fluor und Chlor, oder Halogenalkyl wie unter R1 genannt, insbesondere Trifluormethyl;
 - R4 Hydroxy;
 - Alkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy;
 - Alkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, sek.-Butyl, iso-Butyl und tert.-Butyl; das eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Alkoxy wie unter R1 genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkoxy wie unter R1 genannt, insbesondere Trifluormethoxy; Alkylthio wie unter R¹ genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio; Halogenalkylthio wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethylthio; Dialkylamino wie unter R1 genannt, insbesondere Dimethylamino und Diethylamino; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Fluor und Chlor; Cycloalkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Cyclopropyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl, oder Phenyl, welches seinerseits ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen, wie bei R¹ genannt, insbesondere Fluor und Chlor; Cyano; Nitro; Alkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Methyl und Ethyl; Halogenalkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethyl; Alkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethoxy; Alkylthio wie unter R¹ genannt, insbesondere
 - Methylthio und Ethylthio, oder Halogenalkylthio wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethylthio; Cycloalkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl und CyclohexyL, das eine bis drei der tolgenden Gruppen tragen kann: Alkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und Isopropyl; Halogenalkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethyl; Alkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluorme-
 - thoxy; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Fluor und Chlor, Nitro oder Cyano; Alkenyl oder C₃-C₆-Alkinyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Aliyi, Methaliyl, Propargyl und 1,1-Dimethyl2-2-propinyl, das ein- bis dreimal durch Halogen wie unter R1 genannt, insbesondere Fluor und Chlor, und/oder einmal durch Phenyl substituiert sein kann, wobei der Phenylrest seinerseits eine bis drei

der folgenden Gruppen tragen kann: Alkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Methyl und Ethyl: Halogenalkyl wie unter R¹ genannt, Insbesondere Trifluormethyl; Alkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkoxy wie unter R¹ genannt, insbesondere Trifluormethoxy; Alkylthio wie unter R¹ genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio; Halogenalkylthio wie unter R1 genannt, insbesondere Trifluormethylthio; Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Fluor und Chlor, Cyano oder Nitro;

ein 5- bis 6-gliedriger heterocyclischer Rest enthaltend ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel oder Stickstoff wie unter R1 genannt, welcher ein bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Alkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und iso-Propyl, oder Halogen wie unter R1 genannt, insbesondere Fluor und Chlor;

Phenyl, das eine bis vier der folgenden Gruppen tragen kann: Alkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Methyl, Ethyl und Isopropyl; Halogenalkyl wie unter R1 genannt, insbesondere Trifluormethyl; Alkoxy wie unter R1 genannt, insbesondere Methoxy und Ethoxy; Halogenalkoxy wie unter R1 genannt, insbesondere Trifluormethoxy; Alkylthio wie unter R¹ genannt, insbesondere Methylthio und Ethylthio; Halogenalkylthio wie unter R1 genannt, insbesondere Trifluormethylthio; Halogen wie unter R1 genannt, insbesondere Fluor und

¹⁵ Chlor; Nitro; Cyano; Formyl; Alkanoyl wie Acetyl, Propionyl, Butyryl, insbesondere Acetyl; Halogenalkanoyl, wie Trifluoracetyl, Trichloracetyl, Pentafluorpropionyl, insbesondere Trifluoracetyl, oder Alkoxycarbonyl wie unter R1 genannt, insbesondere Methoxycarbonyl;

Naphthyl, das ein- bis dreimal durch Alkyl wie unter R¹ genannt, insbesondere Methyl und Ethyl, oder Halogen wie unter R¹ genannt, insbesondere Fluor und Chlor substituiert sein kann,

oder

R³ und R⁴ gemeinsam einen Rest der Struktur -(CH₂)_n-Y_p-(CH₂)_q-, wobei n und q 1, 2 oder 3, p 0 oder 1 und Y Sauerstoff, Schwefel oder N-Methyl wie -(CH₂)₃-, -(CH₂)₄-, -(CH₂)₅-, -(CH₂)₆-, -CH₂-O-CH₂-, -CH₂-CH2-O-CH2-CH2-, -CH2-S-CH2-, -CH2-CH2-CH2-, -CH2-CH2-, -CH2-CH2-, -CH2-CH2-, insbesondere -(CH2)-5- und -CH2-CH2-O-CH2-CH2-, oder den Rest der Formel -(CH2)3-CO- bilden können;

sowie deren umweltverträglichen Salze.

Insbesondere bevorzugt sind Verbindungen la und lb, in denen R3 Wasserstoff bedeutet sowie solche, in denen die Substituenten folgende Bedeutung haben:

R1 Wasserstoff;

Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl und 1,1-Dimethylethyl;

Methoxy, Ethoxy, Propyloxy, 1-Methylethoxy, Butyloxy, 1-Methylpropyloxy, 2-Methylpropyloxy und 1,1-Dimethylethoxy;

Difluormethoxy und Trifluormethoxy;

Methylthio, Ethylthio, Propylthio, 1-Methylethylthio, Butylthio, 1-Methylpropylthio, 2-Methylpropylthio und 1,1-Dimethylethylthio;

Difluormethylthio und Trifluormethylthio;

R² einen Rest -COYR⁵;

R5

Wasserstoff; Phthalimido; Succinimido; Maleinimido, oder einen Rest -N = CR⁶R⁷; R6, R7

Wasserstoff;

Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl und 1,1-Dimethylethyl; Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl und Cycloheptyl;

oder gemeinsam eine 4- bis 7-gliedrige Alkylenkette wie -CH2CH2CH2CH2CH2-, -CH2CH2CH2CH2CH2-, -CH2CH2CH2CH2CH2CH2- und -CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2-;

R⁴ Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl und 1,1-Dimethylethyl; Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl und Cycloheptyl; oder gemeinsam eine 4- bis 7-gliedrige Alkylenkette wie -CH2CH2CH2CH2-, -CH2CH2CH2CH2CH2-, -CH2CH2CH2CH2CH2CH2- und -CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2CH2-;

Beispiele für sehr aktive Verbindungen der Formeln la und Ib sind in den nachstehenden Tabellen aufgeführt:

Tabelle A

R¹ X R²

Ia (x = 0 oder S)

			•	
	R1	R2	R3	R4
10	H	СООН	Н	tertButyl
	 F	СООН	Н	tertButyl
	c1	СООН	H	tertButyl
	Methyl	СООН	н	tertButyl
15	Ethyl	СООН	H	tertButyl
15	n-Propyl	COOH	H	tertButyl
	iso-Propyl	СООН	Н	tertButyl
	n-Butyl	соон	н	tertButyl
	iso-Butyl	СООН	Н	tertButyl
20	sekButyl	COOH	н	tertButyl
	tertButyl	СООН	Н	tertButyl
	cyclo-Propyl	COOH	Н	tertButyl
	cyclo-Butyl	соон	н	tertButyl
25	cyclo-Pentyl	соон	н	tertButyl
	cyclo-Hexyl	СООН	н	tertButyl
	cyclo-Heptyl	СООН	н	tertButyl
	cyclo-Octyl	СООН	н	tertButyl
	1-Methylcyclopropyl	СООН	н	tertButyl
30	Trifluormethyl	COOH	н	tertButyl
	Chlordifluormethyl	СООН	Н	tertButyl
	Pentafluorethyl	. соон	Н	tertButyl
	Methoxymethyl	COOH	н	tertButyl
35	1-Methylmethoxymethyl	СООН	Н	tertButyl
	1-Methy lmethoxyethy l	COOH	н	tertButyl
	Ethoxymethyl	COOH	Н	tertButyl
	Vinyl	COOH	Н	tertButyl
40	Allyl	COOH	н	tertButyl
	Methallyl	COOH	н	tertButyl
	Crotyl	COOH	Н	tertButyl
	Ethinyl	СООН	н	tertButyl
	Propargyl	COOH	н	tertButyl
45	Phenylethinyl	COOH	Н	tertButyl
	Methoxy	соон	н	tertButyl
	Ethoxy	соон	Н	tertButyl
	Trifluormethoxy	СООН	н	tertButyl
50	Methylthio	соон	Н	tertButyl
	Meenla ranna			

55

R1	R2	R 3	R ⁴
Trifluormethylthio	СООН	н .	tertButyl
Phenoxy	СООН	н	tertButyl
4-C1-Phenoxy	СООН	н	tertButyl
2,4-(C1,C1)-Phenoxy	СООН	н	tertButyl
4-CF ₃ -Phenoxy	СООН	н	tertButyl
Phenyl	соон	Н	tertButyl
2-F-Phenylthio	СООН	Н	tertButyl
3-F-Phenyl	СООН	Н	tertButyl
2,4-(F,F)-Pheny1	СООН	H	tertButyl
2-Cl-Phenyl	СООН	Н	tertButyl
3-Cl-Phenyl	СООН	н	tertButyl
2,4-(C1,C1)-Phenyl	СООН	н	tertButyl
2-CH ₃ -Phenyl	COOH	н	tertButyl
3-CH ₃ -Phenyl	СООН	н	tertButyl
4-CH ₃ -Phenyl	СООН	Н	tertButyl
2, 4-(CH ₃ , CH ₃)-Phenyl	СООН	н	tertButyl
2, 4, 6- (CH ₃ , CH ₃ , CH ₃)-Phenyl	СООН	Н	tertButyl
2-CF ₃ -Phenyl	СООН	Н	tertButyl
2-OCH ₃ -Phenyl	COOH	н	tertButyl
2, 4-(OCH ₃ , OCH ₃)-Phenyl	COOH	н	tertButyl
4-OCF ₃ -Phenyl	СООН	Н	tertButyl
4-SCH ₃ -Pheny1	СООН	Н	tertButyl
3-SCF ₃ -Phenyl	COOH	н	tertButyl
2, 4-(NO ₂ , NO ₂)-Phenyl	COOH	Н	tertButyl
4-NO ₂ -Pheny l	СООН	Н	tertButyl
_	COOH	Н	tertButyl
2-Thienyl	COOH	н	tertButyl
3-Thienyl 2-Furanyl	СООН	н	tertButyl
_	СООН	Н	tertButyl
3-Furanyl 2-Tetrahydrofuranyl	COOH	Н	tertButyl
3-Tetrahydrofuranyl	СООН	н	tertButyl
2-Pyridyl	СООН	н	tertButyl
-	СООН	н	tertButyl
3-Pyridyl	СООН	н	tertButyl
4-Pyridyl	СООН	н	tertButyl
2-Tetrahydropyranyl	COOH	H	tertButyl
3-Tetrahydropyranyl	СООН	н	tertButyl
4-Tetrahydropyranyl	COOH	Н	tertButyl
iso-Propoxy	COOH	н	cyclo-Propyl
н	COOH	н	cyclo-Propyl
F Cl	COOH	н	cyclo-Propyl

	R1	. R2	R3	R4
		COOH	H	cyclo-Propyl
	Methyl	•		cyclo-Propyl
	Ethyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
	n-Propyl	COOH	H	cyclo-Propyl
	iso-Propyl	COOH	н	cyclo-Propyl
	n-Butyl	СООН	Н	cyclo-Propyl
	iso-Butyl	СООН	H	cyclo-Propyl
	sekButyl	COOH	H	
	tertButyl	СООН	H	cyclo-Propyl
	cyclo-Propyl	COOH	н	cyclo-Propyl
	cyclo-Butyl	COOH	н	cyclo-Propyl
	cyclo-Pentyl	COOH	н	cyclo-Propyl
	cyclo-Hexyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
	cyclo-Heptyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
	cyclo-Octyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
	1-Methylcyclopropyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
	Trifluormethyl	COOH	H	cyclo-Propyl
	Chlordifluormethyl	COOH	н	cyclo-Propyl
	Pentafluorethyl	COOH	н	cyclo-Propyl
	Methoxymethyl	соон	н	cyclo-Propyl
	1-Methylmethoxymethyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
	1-Methylmethoxyethyl	СООН	H	cyclo-Propyl
	Ethoxymethy l	COOH	н	cyclo-Propyl
	·	СООН	н	cyclo-Propyl
	Vinyl	соон	н	cyclo-Propyl
	Allyl	соон	н	cyclo-Propyl
	Methallyl	COOH	н	cyclo-Propyl
	Crotyl	соон	н	cyclo-Propyl
	Ethinyl	СООН	н	cyclo-Propyl
	Propargyl	СООН	н	cyclo-Propyl
	Pheny lethiny l	СООН	н	cyclo-Propyl
	Methoxy	СООН	н	cyclo-Propyl
	Ethoxy	COOH	н	cyclo-Propyl
	Trifluormethoxy	COOH	н	cyclo-Propyl
	Methylthio	COOH	н	cyclo-Propyl
	Trifluormethylthio	COOH	н	cyclo-Propyl
	Phenoxy	COOH	H	cyclo-Propyl
	4-Cl-Phenoxy		H	cyclo-Propyl
	2,4-(C1,C1)-Phenoxy	COOH		cyclo-Propyl
)	4-CF ₃ -Phenoxy	COOH	•	cyclo-Propyl
	Phenyl	COOH		cyclo-Propyl
	2-F-Phenylthio	COOH		cyclo-Propyl
	3-F-Phenyl	COOH		cyclo-Propyl
5	2,4-(F,F)-Phenyl	соон	н	cyclo opj.

	R1	R2	R3 .	R4
5				<u> </u>
	2-C1-Phenyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
	3-C1-Pheny1	СООН	н	cyclo-Propyl
	2,4-(C1,C1)-Phenyl	СООН	н	cyclo-Propyl
10	2-CH ₃ -Phenyl	СООН	Н	cyclo-Propyl
	3-CH ₃ -Phenyl	COOH	н	cyclo-Propyl
	4-CH ₃ -Phenyl	СООН	н	cyclo-Propyl
	2, 4-(CH ₃ , CH ₃)-Phenyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
15	2, 4, 6-(CH ₃ , CH ₃ , CH ₃)-Phenyl	COOH	н	cyclo-Propyl
	2-CF ₃ -Phenyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
	2-OCH ₃ -Phenyl	СООН	Н	cyclo-Propyl
	2,4-(OCH ₃ ,OCH ₃)-Phenyl	СООН	Н	cyclo-Propyl
20	4-OCF 3-Pheny l	COOH	H	cyclo-Propyl
	4-SCH ₃ -Phenyl	COOH	н	cyclo-Propyl
	3-SCF ₃ -Phenyl	СООН	Н	cyclo-Propyl
	2, 4-(NO ₂ , NO ₂)-Phenyl	СООН	Н	cyclo-Propyl
05	4-NO ₂ -Phenyl	СООН	Н	cyclo-Propyl
25	2-Thienyl	COOH	H	cyclo-Propyl
	3-Thienyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
	2-Furanyl	COOH	н	cyclo-Propyl
	3-Furanyl	COOH	н	cyclo-Propyl
30	2-Tetrahydrofuranyl	СООН	Н	cyclo-Propyl
	3-Tetrahydrofuranyl	COOH	H	cyclo-Propyl
	2-Pyridyl	COOH	н	cyclo-Propyl
	3-Pyridyl	COOH	н	cyclo-Propyl
35	4-Pyridyl	СООН	н	cyclo-Propyl
	2-Tetrahydropyranyl	COOH	н	cyclo-Propyl
	3-Tetrahydropyranyl	COOH	н	cyclo-Propyl
	4-Tetrahydropyranyl	COOH	н	cyclo-Propyl
40	iso-Propoxy	СООН	н	cyclo-Propyl
	Н	COOH	Methyl	tertButyl
	F	СООН	Methyl	tertButyl
	Cl	СООН	Methyl	tertButyl
45	Methyl	COOH	Methyl	tertButyl
	Ethyl	COOH	Methyl	tertButyl
	n-Propyl	СООН	Methyl	tertButyl
	iso-Propyl	COOH	Methyl	tertButyl
50	n-Butyl	соон	Methyl	tertButyl
50	iso-Butyl	СООН	Methyl	tertButyl
	sekButyl	COOH	Methyl	tertButyl
	tertButyl	COOH	Methyl	tertButyl
	cyclo-Propyl	COOH	Methyl	tertButyl
55	cyclo-Butyl	COOH	Methy l	tertButyl

R1	R2	R3	R4
	СООН	Methyl	tertButyl
cyclo-Pentyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
cyclo-Hexyl		iso-Propyl	tertButyl
cyclo-Heptyl	COOH	• =	tertButyl
cyclo-Octyl	СООН	iso-Propyl	tertButyl
1-Methylcyclopropyl	СООН	iso-Propyl	tertButyl
Trifluormethyl	СООН	iso-Propyl	
Chlordifluormethyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Pentafluorethyl	СООН	iso-Propyl	tertButyl
Methoxymethyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
1-Methylmethoxymethyl	соон	iso-Propyl	tertButyl
1-Methylmethoxyethyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Ethoxymethyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Vinyl	COOH	i so-Propy l	tertButyl
Allyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Methallyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Crotyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Ethinyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Propargyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Phenylethinyl	СООН	iso-Propyl	tertButyl
Methoxy	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Ethoxy	СООН	iso-Propyl	tertButyl
Trifluormethoxy	СООН	iso-Propyl	tertButyl
н	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
 F	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
C1	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
Methyl	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
Ethyl	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
n-Propyl	соон	Methyl .	cyclo-Propyl
iso-Propyl	соон	Methyl	cyclo-Propyl
n-Butyl	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
iso-Butyl	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
sekButyl	соон	iso-Propyl	tertButyl
tertButyl	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
cyclo-Propyl	COOH	iso-Propyl	cyclo-Propyl
cyclo-Butyl	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
cyclo-Pentyl	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
cyclo-Hexyl	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
cyclo-Heptyl	соон	Methy l	cyclo-Propyl
cyclo-Octyl	СООН	Methy 1	cyclo-Propyl
1-Methylcyclopropyl	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
Trifluormethyl			cyclo-Propyl
Chlordifluormethyl	СООН	wern'y .	

R1	R2	R3	R4
Pentafluorethyl	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
Methoxymethyl	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
1-Methylmethoxymethyl	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
1-Methylmethoxyethyl	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
-	COOH	iso-Propyl	cyclo-Propyl
Ethoxymethyl	COOH	iso-Propyl	cyclo-Propyl
Vinyl	COOH	iso-Propyl	cyclo-Propyl
Allyl	COOH	iso-Propyl	cyclo-Propyl
Methallyl	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
Crotyl	СООН	Methy l	cyclo-Propyl
Ethinyl	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
Propargyl	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
Pheny lethiny l	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
Methoxy	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
Ethoxy Trifluormethoxy	COOH	Methyl	cyclo-Propyl

Tabelle B

Ethinyl

Methoxy

Ethoxy

50

Propargyl

Phenylethinyl

Trifluormethoxy

Methylthio

16	inerie b	R 2		
		R1 X R	3	Ib (x = 0 oder S)
		~R 0	•	
R	1	R2	R3	R4
		СООН	н	tertButyl
Н		СООН	Н	tertButyl
F		СООН	Н	tertButyl
	1	СООН	Н	tertButyl
	lethy l	COOH	н	tertButyl
	thyl	СООН	Н	tertButyl
	n-Propyl	СООН	Н	tertButyl
	iso-Propyl	COOH	н	tertButyl
	n-Buty I	COOH	Н	tertButyl
	iso-Butyl	СООН	Н	tertButyl
	sekButyl	COOH	Н	tertButyl
	tertButyl	СООН	Н	tertButyl
	cyclo-Propyl	СООН	н	tertButyl
	cyclo-Butyl	COOH	н	tertButyl
	cyclo-Pentyl	COOH	н	tertButyl
	cyclo-Hexyl	СООН	н	tertButyl
	cyclo-Heptyl	COOH	н	tertButyl
	cyclo-Octyl	COOH	н	tertButyl
	1-Methylcyclopropyl	COOH	н	tertButyl
	Trifluormethyl	COOH	н	tertButyl
	Chlordifluormethyl	COOH	н	tertButyl
	Pentafluorethyl	COOH	н	tertButyl
	Methoxymethyl	COOH	н	tertButyl
	1-Methy Imethoxymethy l	COOH	н	tertButyl
	1-Methylmethoxyethyl	COOH	н	tertButyl
	Ethoxymethyl	COOH	н	tertButyl
	Vinyl	COOH	н	tertButyl
	Allyl	COOH	н	tertButyl
	Methallyl	COOH	н	tertButyl
	Crotyl	COOH	н	tertButyl
	Ethinyl	COOR	• •	tost -Rutyl

COOH

COOH

COOH

COOH

COOH

COOH

н

Н

Н

н

H

tert.-Butyl

tert.-Butyl

tert.-Butyl

tert.-Butyl

tert.-Butyl

tert.-Butyl

5	R1	R2	R3 ·	R4
	Trifluormethylthio	СООН	н	tertButyl
	Phenoxy	СООН	Н	tertButyl
	4-C1-Phenoxy	СООН	H	tertButyl
10	2,4-(Cl,Cl)-Phenoxy	СООН	H	tertButyl
	4-CF ₃ -Phenoxy	СООН	н	tertButyl
	Phenyl	СООН	Н	tertButyl
	2-F-Phenylthio	СООН	Н	tertButyl
15	3-F-Phenyl	СООН	Н	tertButyl
	2,4-(F,F)-Phenyl	СООН	Н	tertButyl
	2-Cl-Phenyl	СООН	н	tertButyl
	3-C1-Pheny1	СООН	н	tertButyl
20	2,4-(C1,C1)-Phenyl	СООН	Н	tertButyl
	2-CH ₃ -Phenyl	СООН	н	tertButyl
	3-CH ₃ -Phenyl	СООН	н	tertButyl
	4-CH ₃ -Phenyl	СООН	н	tertButyl
25	2,4-(CH ₃ ,CH ₃)-Phenyl	COOH	н	tertButyl
23	2, 4, 6-(CH ₃ , CH ₃ , CH ₃)-Phenyl	COOH	н	tertButyl
	2-CF ₃ -Phenyl	СООН	н	tertButyl
	2-OCH ₃ -Phenyl	СООН	Н	tertButyl
	2, 4-(OCH ₃ , OCH ₃)-Pheny l	СООН	н	tertButyl
30	4-OCF ₃ -Pheny l	COOH	н	tertButyl
	4-SCH ₃ -Phenyl	СООН	н	tertButyl
	3-SCF ₃ -Phenyl	COOH	н	tertButyl
	2, 4-(NO ₂ , NO ₂)-Phenyl	COOH	н	tertButyl
35	4-NO ₂ -Pheny l	COOH	Н	tertButyl
	2-Thienyl	COOH	Н	tertButyl
	3-Thienyl	COOH	Н	tertButyl
	2-Furanyl	COOH	Н	tertButyl
40	3-Furanyl	COOH	Н	tertButyl
	2-Tetrahydrofuranyl	COOH	Н	tertButyl
	3-Tetrahydrofuranyl	СООН	н	tertButyl
	2-Pyridyl	COOH	н	tertButyl
45	3-Pyridyl	COOH	н	tertButyl
	4-Pyridyl	COOH	Н	tertButyl
	2-Tetrahydropyranyl	COOH	н	tertButyl
	3-Tetrahydropyranyl	COOH	н	tertButyl
50	4-Tetrahydropyranyl	COOH	н	tertButyl
	iso-Propoxy	COOH	н	tertButyl
	Н	COOH	Н	cyclo-Propyl
	F	COOH	Ä	cyclo-Propyl
	Cl	COOH	н	cyclo-Propyl
55	Methyl	COOH	Н	cyclo-Propyl

R1	R2	R3	R4
Ethyl	СООН	н	cyclo-Propyl
n-Propyl.	СООН	Н .	cyclo-Propyl
iso-Propyl	СООН	Н	cyclo-Propyl
n-Butyl	COOH	H	cyclo-Propyl
iso-Butyl	СООН	Н	cyclo-Propyl
sekButyl	СООН	Н	cyclo-Propyl
	СООН	H	cyclo-Propyl
tertButyl cyclo-Propyl	СООН	н	cyclo-Propyl
•	СООН	Н	cyclo-Propyl
cyclo-Butyl	СООН	H	cyclo-Propyl
cyclo-Pentyl	СООН	н	cyclo-Propyl
cyclo-Hexyl	COOH	н	cyclo-Propyl
cyclo-Heptyl	COOH	н	cyclo-Propyl
cyclo-Octyl	COOH	н	cyclo-Propyl
1-Methylcyclopropyl	COOH	н	cyclo-Propyl
Trifluormethyl	COOH	н	cyclo-Propyl
Chlordifluormethyl	COOH	H	cyclo-Propyl
Pentafluorethyl		H	cyclo-Propyl
Methoxymethy l	COOH		cyclo-Propyl
1-Methylmethoxymethyl	COOH	H	cyclo-Propyl
1-Methylmethoxyethyl	COOH	H	cyclo-Propyl
Ethoxymethyl	COOH	H	cyclo-Propyl
Vinyl	COOH	н	cyclo-Propyl
Allyl	СООН	Н	cyclo-Propyl
Methallyl	СООН	H 	-
Crotyl	СООН	H	cyclo-Propyl cyclo-Propyl
Ethinyl	СООН	H	
Propargyl	СООН	Н	cyclo-Propyl
Pheny lethiny l	СООН	H	cyclo-Propyl
Methoxy	СООН	н	cyclo-Propyl
Ethoxy	СООН	Н	cyclo-Propyl
Trifluormethoxy	COOH	Н	cyclo-Propyl
Methylthio	COOH	Н	cyclo-Propyl
Trifluormethylthio	СООН	н	cyclo-Propyl
Phenoxy	COOH	Н	cyclo-Propyl
4-C1-Phenoxy	СООН	Н	cyclo-Propyl
2,4-(Cl,Cl)-Phenoxy	СООН	Н	cyclo-Propyl
4-CF ₃ -Phenoxy	COOH	Н	cyclo-Propyl
Phenyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
2-F-Phenylthio	COOH	н	cyclo-Propyl
3-F-Pheny l	COOH	H	cyclo-Propyl
2,4-(F,F)-Phenyl	СООН	Ĥ	cyclo-Propyl
2-C1-Phenyl	COOH	н	cyclo-Propyl

R1	R2	R3	R4
3-C1-Pheny l	СООН	н	cyclo-Propyl
•	СООН	н	cyclo-Propyl
2,4-(C1,C1)-Phenyl	COOH -	H	cyclo-Propyl
2-CH ₃ -Phenyl		H	cyclo-Propyl
3-CH ₃ -Phenyl	COOH	H	cyclo-Propyl
4-CH ₃ -Phenyl	COOH	# H	cyclo-Propyl
2,4-(CH ₃ ,CH ₃)-Phenyl	COOH		cyclo-Propyl
2, 4, 6-(CH ₃ , CH ₃ , CH ₃)-Phenyl	COOH	H H	cyclo-Propyl
2-CF ₃ -Phenyl	COOH	H	cyclo-Propyl
2-OCH ₃ -Phenyl	COOH		cyclo-Propyl
2, 4-(OCH ₃ , OCH ₃)-Phenyl	COOH	H	cyclo-Propyl
4-OCF ₃ -Phenyl	COOH	H	cyclo-Propyl
4-SCH ₃ -Phenyl	СООН	Н	
3-SCF ₃ -Phenyl	COOH	H	cyclo-Propyl
2, 4-(NO ₂ , NO ₂)-Phenyl	COOH	H 	cyclo-Propyl
4-NO ₂ -Pheny l	СООН	н	cyclo-Propyl
2-Thienyl	СООН	H	cyclo-Propyl
3-Thienyl	COOH	H	cyclo-Propyl
2-Furanyl	СООН	Н	cyclo-Propyl
3-Furanyl	СООН	Н	cyclo-Propyl
2-Tetrahydrofuranyl	соон	Н	cyclo-Propyl
3-Tetrahydrofuranyl	СООН	н	cyclo-Propyl
2-Pyridyl	COOH	Н	cyclo-Propyl
3-Pyridyl	COOH	н	cyclo-Propyl
4-Pyridyl	COOH	н	cyclo-Propyl
2-Tetrahydropyranyl	COOH	н	cyclo-Propyl
3-Tetrahydropyranyl	COOH	H	cyclo-Propyl
4-Tetrahydropyranyl	COOH	н	cyclo-Propyl
iso-Propoxy	COOH	Н	cyclo-Propyl
н	COOH	Methyl .	tertButyl
F	COOH	Methyl	tertButyl
Cl	СООН	Methyl	tertButyl
Methyl	COOH	Methyl	tertButyl
Ethyl	COOH	Methyl	tertButyl
n-Propyl	COOH	Methyl	tertButyl
iso-Propyl	COOH	Methyl	tertButyl
n-Butyl	COOH	Methyl	tertButyl
iso-Butyl	COOH	Methyl	tertButyl
sekButyl	СООН	Methyl	tertButyl
tertButyl:	COOH	Methy l	tertButyl
cyclo-Propyl	COOH	Methyl	tertButyl
cyclo-Butyl	COOH	Methyl	tertButyl
cyclo-Pentyl	СООН	Methyl	tertButyl

R1	R2	R3 .	R4
auala-Hawul	СООН	iso-Propyl	tertButyl
cyclo-Hexyl cyclo-Heptyl	СООН	iso-Propyl	tertButyl
cyclo-neptyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
•	COOH	iso-Propyl	tertButyl
1-Methylcyclopropyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Trifluormethyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Chlordifluormethyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Pentafluorethyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Methoxymethyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
1-Methylmethoxymethyl		iso-Propyl	tertButyl
1-Methylmethoxyethyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Ethoxymethy1	COOH	• •	tertButyl
Vinyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Allyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Methallyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Crotyl	СООН	iso-Propyl	tertButyl
Ethinyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Propargyl	СООН	iso-Propyl	
Phenylethinyl	СООН	iso-Propyl	tertButyl
Methoxy	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Ethoxy	СООН	iso-Propyl	tertButyl
Trifluormethoxy	COOH	iso-Propyl	tertButyl
Н	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
F	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
C1	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
Methyl	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
Ethyl	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
n-Propyl	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
iso-Propyl	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
n-Buty l	COOH	iso-Propyl	cyclo-Propyl
iso-Butyl	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
sekButyl	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
tertButyl	COOH	iso-Propyl	tertButyl
cyclo-Propyl	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
cyclo-Butyl	COOH	iso-Propyl	cyclo-Propyl
cyclo-Pentyl	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
cyclo-Hexyl	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
cyclo-Heptyl	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
cyclo-Octyl	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
1-Methylcyclopropyl	СООН	Methy 1	cyclo-Propyl
Trifluormethyl	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
Chlordifluormethyl	COOH	Methy l	cyclo-Propyl
Pentafluorethyl	СООН	Methyl	cyclo-Propyl

<u>R1</u>	RZ	R3 ·	R4
Methoxymethy l	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
1-Methylmethoxymethyl	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
1-Methylmethoxyethyl	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
Ethoxymethy l	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
Vinyl	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
Allyl	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
Methallyl	СООН	iso-Propyl	cyclo-Propyl
Crotyl	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
Ethinyl	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
Propargyl	СООН	Methy1	cyclo-Propyl
Phenylethinyl	СООН	Methyl	cyclo-Propyl
Methoxy	СООН	Methy l	cyclo-Propyl
Ethoxy	COOH	Methyl	cyclo-Propyl
Trifluormethoxy	соон	Methyl	cyclo-Propyl

5	-	×	o s	s 0	s 0	o s	s 0	0 \$	0 S	s 0	s 0	s 0	s 0	s 0	s 0	s 0	o s	s 0	s 0	s 0	o s
15	<u>a</u>		4-Hydroxy-2-butinyl	2	-C3H5)2	ino	nimino	nimino		2-Furyl-methanimino	H3)2	CH ₃) ₃ I ⁻					СН3) з	=C(CH ₃) ₂	H5) 2	(OCH ₃) ₂	2H5) 2
20	0 X X X X X X X X X X X X X X X X X X X	RS	4-Hydroxy	N=C(C2H5)2	N=C(cyclo-C3H5)2	2-Butanimino	Cyclohexanimino	Cyclooctanimino	N=CH-C ₆ H ₅	2-Furyl-m	CH2CH2N(CH3)2	CH2CH2N+(CH3)	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₂ C ₁	CH ₂ CH ₂ CN	CH2CC13	CH ₂ CH ₂ Si(CH ₃) ₃	CH2CH20-N=C(CH3)2	CH2PO(0C2H5)2	сн(сн ₃)сн(осн ₃) ₂	CH2-CON(C2H5)2
30	bzw. R1																				
35	3 54 Ia	R4	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl
40 45		R.3	.	I	I	I	I	I	I	I	Ŧ	Ξ	I	I	Ξ	I	I	Ξ	Ξ	I	Ŧ
50	~						•				-			_	_	ropyl	ropvl	ropyl	ropyl	so-Propyl	ropyl
55		č	Chlor	Chlor	Chlor	Chlor	Chlor	Chlor	Methy	Methyl	Methyl	Methyl	Methyl	Methyl	Methyl	iso-Propy	iso-Propv	1so-Propy	i so-Proby	1 so-P	iso-Propy

50 55	45	40		35	30	25	20	15	10	5	
		æ	4	i			25			×	>-
											_
iso-Propyl		I	tertButyl	utyl			Benzyl			S	0
cyclo-Propyl		I	tertButy	utyl			2,4-(C1,C1)-Benzyl	-Benzyl		S	0
cyclo-Propyl		I	tertButy	utyl			3-Pyridyl-methyl	ethyl		S	0
cyclo-Propyl		I	tertButy	utyl			2-Thienyl-methyl	ethyl		ဟ	0
cyclo-Propyl		I	tertButyl	utyl			2-Tetrahydr	2-Tetrahydrofuranyl-methyl	hyl	S	0
cyclo-Propyl		I	tertButyl	utyl			2-Furanyl-methyl	ethyl		S	0
cyclo-Propyl		I	tertButyl	utyl			2-Pyridyl-methyl	ethy1		S	0
cyclo-Propyl		I	tertButy	utyl			Phenyl			တ	0
Allyl		I	tertButy	utyl			4-F-Phenyl			S	0
Allyl		I	tertButy	utyl			4-Trifluormethylphenyl	ethylphenyl		S	0
Allyl		I	tertButy	luty1			2-N0 ₂ -4-F-Pheny l	henyl		တ	0
Allyl		I	tertButy	lutyl			3, 5-(CF3, CF3)-Phenyl	3)-Phenyl		S	0
Allyl		I	tertButy	lutyl			4-0CH3-Pheny	l y		တ	0
Allyl		I	tertButy	utyl			4-0CF 3-Pheny l	y l		S	0
Allyl		I	tertButy	lutyl			4-NHCOCH ₃ -Phenyl	henyl		S	0
Ethinyl		I	tertButy	utyl			2-Tetrahydropyranyl	opyranyl		S	0
Ethinyl		I	tertButy	utyl			2-Tetrahydropyranyl	opyranyl		S	0
Ethinyl		I	tertButy	outyl			1-Benzotriazolyl	zolyl		S	0
Ethinyl		I	tertButy	luty1			Methyl			S	0
Ethinyl		I	tertButy	auty).			Ethyl			S	0
Ethinyl		I	tertButy	3uty]			n-Propyl			S	0
Ethinyl		I	tertButy	Jutyl			iso-Propyl			S	0
Methoxy		I	tertButy	3uty l			n-Butyl			S	0
Methoxy		I	tertButy	3uty1			iso-Butyl			S	0
Methoxy		I	tertButyl	3uty1			sekButyl			S	0

55	50	45	40		35	30	25	20	15	10	5		
R1			E2	R4	-			RS			×	-	1
			3	tort - Butt	204.01			tertButvl			S	-0	
Methoxy			: 3	tone - but	30401			CVC 10-Hexv1			S	. 0	
Methoxy.			E :	ָר	outy:			Cyclemeny:	1444		·		
Methoxy			I	tertButy	Butyl			Cyc topropy time city t	cii) i		, ()	
Methoxy			Ŧ	tertButy	Butyl			Ethoxymethy1			S	0	
4-C1-Phenox	noxy		I	tertButy	Butyl			2-Methoxy-ethoxy-methyl	hoxy-methyl	_	S	0	
4-Cl-Phenoxy	YXOU		I	tertButy	Butyl			Benzyloxymethyl	ly!		S	0	
4-C1-Phenoxy) XOU	···'.	I	tertButy	Butyl			(4-Brombenzoyl)-methyl	yl)-methyl		S	0	
4-C1-Phenoxy	AXOU		I	tertButy	Butyl			(4-Methoxybenzoyl)-methyl	nzoyl)-meth	ıyı	s	0	
A-C1-Phenoxy	AXOU		I	tertButy	Butyl			Phthalimidomethy	ethyl		S	0	
4-C1-Phenoxy	X X Q II		I	tertButy	Butyl			Methylthiomethy]	thyl		S	0	
VXCHAHO-17-A	\ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \		I	tertButy	Butyl		•	2-Thiomethyl-ethyl	-ethyl		S	0	
Phenvlthio	10		I	tertButyl	Butyl			сн(с ₆ н ₅)соосн ₃	H ₃		S	0	
Pheny 1 thio			I	tertButy	Butyl			Phenylethyl			S	0	
Phehv1thio	0		÷	tertButy	Butyl			4-F-Phenylethy	hyl		S	0	
Pheny 1thio	9		I	tertButy	Butyl			Phthalimido			S	0	
Phenylthio	9		I	tertButy	Butyl			Tetrahydrophthalimido	thalimido		S	0	
Pheny I thio	0,1		I	tertButy	Butyl			Maleinimido			S	0	
Pheny 1 thio	0		I	tertButy	Butyl			Succinimido			တ	0	
2.4-(C1.	2.4-(C1.C1)-Phenyl		Ξ	tert	Butyl		٠	Piperidino			S	0	
2, 4-(C1.	2, 4-(C1, C1)-Phenyl		±	tertButy	Butyl			Li ⁺			S	0	
2, 4-(C).	2, 4-(C1, C1)-Phenyl		I	tertButy	Butyl			Na ⁺			S	·0	
7 4-(61	C11-Phenyl		Ξ	tertButy	Butyl			*			S	0	
7 4-(61	2,4 (C1,C1)-Phenyl		Ξ	tertButy	Butyl			+ * HN			S	0	
2, 4 - (C1,	2, 4-(C1, C1) -Phenyl		I	tertButy	Butyl			Diisopropylammonium	mmon i um		S	0	
2,4-(C1,	2, 4-(C1, C1)-Phenyl		=	tertButy	Butyl			2-Hydroxyethyl-ammonium	yl-ammoniu	F	S	0	
,													

55	50	4 5	40	35	30	25	20	15	10	. 5	
R1		R.3	*			æ	R5			×	>
											_
2-Thienyl		=	tert,	tert, -Butyl		⋖	Allyl			s	0
2-Thienyl		Ξ	tert.	tertButyl		Ĩ	Methallyl			S	0
2-Thienyl		I	tert.	tertButyl		7	2-Chlorallyl			S	0
2-Thienyl		I	tert.	tertButyl		ā	Propargy1			s	0
2-Thienyl		I	tert.	tertButyl		_w	3-fodpropargyl			S	0
Chlor		I	cyclo	cyclo-Propyl		4	4-Hydroxy-2-butiny	tinyl		S	0
Chlor		I	cyclo	cyclo-Propyl		Ž	N=C(C2H5)2			, vs	0
Chlor		I	cyclo-	cyclo-Propyl		Ž	N=C(cyclo-C3H5)2),		S	0
Chlor		=	cyc 10-	cyclo-Propyl		5.	2-Butanimino			S	0
· Chlor		I	cyclo-	cyclo-Propyl		ΰ'	Cyclohexanimino	0		S	0
Chlor		I	cyclo-	cyclo-Propyl		ົວ	Cyclooctanimino	•		S	0
Methyl	•	I	cyclo-	cyclo-Propyl		ë	N=CH-C ₆ H ₅			S	0
Methyl		Ξ	cyclo-	cyclo-Propyl		7-	2-Furyl-methanimino	imino		S	
Methyl		I	cyclo-	cyclo-Propyl		5	CH2CH2N(CH3)2			s	0
Methyl		I	cyclo-	cyclo-Propyl		Ö	CH2CH2N+(CH3)3I	_1		s	0
Methyl		I	cyclo-	cyclo-Propyl		Ċ	CH ₂ CF ₃			S	0
Methyl		I	cyc 10-	cyclo-Propyl		Ö	CH2CH2C1			s	0
Methyl		I	cyclo-	cyclo-Propyl		5	CH ₂ CH ₂ CN			S	0
iso-Propyl		I	cyclo-	cyclo-Propyl		ರ	CH ₂ CCl ₃			s	0
iso-Propyl		I	cyclo-	cyclo-Propyl		ວັ	CH2CH2Si (CH3) 3			s	0
iso-Propyl		I	cyclo	cyclo-Propyl		ວັ	CH2CH20-N=C(CH3)2	3)2		S	
iso-Propyl		I	cyclo	cyclo-Propyl		ರ	CH2PO(0C2H5)2			s	_
iso-Propyl		I	cyclo	cyclo-Propyl		ວ <u>ີ</u>	сн(сн3)сн(осн3)) 2		S	0
iso-Propyl		I	cyclo	cyclo-Propyl		ಶ	CH2-CON(C2H5)2			s	0
iso-Propyl		I	cyclo	cyclo-Propyl		BE	Benzyl			s	0

55	50	4 5	40	35	30	25	20	15	10	5		
1			R3	R4			RS			×	>	
											_	
cyclo-Propy	pyl	-	I	cyclo-Propyl			2, 4-(C1, C1)-Benzyl)-Benzyl		S	•	
cyclo-Propy	pyl		I	cyclo-Propyl			3-Pyridyl-methyl	methyl		S	0	
cyclo-Propy	pyl		I	cyclo-Propyl			2-Thienyl-methy	methyl		S	0	
cyclo-Propy	pyl		I	cyclo-Propyl			2-Tetrahyd	2-Tetrahydrofuranyl-methyl	ethyl	S	0	
cyclo-Propy	l yd l		I	cyclo-Propyl		•	2-Furanyl-methy	methy		S	0	
cyclo-Propy	pyl		I	cyclo-Propyl			2-Pyridyl-methyl	nethyl		S	0	
cyclo-Propy	pp 1		I	cyclo-Propyl			Pheny l			S	0	
Allyl			Ξ	cyclo-Propyl			4-F-Phenyl			S	0	
Allyl			I	cyclo-Propyl			4-Trifluor	4-Trifluormethylphenyl	_	S	0	
Allyl			I	cyclo-Propyl			2-NO ₂ -F-Phenyl	enyl		s	0	
Allyl			Ŧ	cyclo-Propyl			3, 5-(CF3, CF3)-Phenyl	F ₃)-Phenyl		S	0	
Allyl			I	cyclo-Propyl			4-OCH ₃ -Pheny	nyl		S	0	
Allyl			I	cyclo-Propyl			4-OCF 3-Pheny l	nyl		S	0	
Allyl			I	cyclo-Propyl			4-NHCOCH ₃ -Phenyl	Phenyl		S	0	
Ethinyl			I	cyclo-Propyl			2-Tetrahydropyrany	ropyranyl		S	0	
Ethinyl			I	cyclo-Propyl			2-Tetrahydrofurany	rofuranyl		S	0	
Ethinyl			Ŧ	cyclo-Propyl			1-Benzotriazoly	azolyl		S	0	
Ethinyl			I	cyclo-Propyl			Methyl			s	0	
Ethinyl			I	cyclo-Propyl			Ethyl			s	0	
Ethinyl		,	I	cyclo-Propyl			n-Propyl			S	0	
Ethinyl			I	cyclo-Propyl			iso-Propyl			S	0	
Methoxy			I	cyclo-Propyl			n-Butyl			s	0	
Methoxy			I	cyclo-Propyl			iso-Butyl			S	0	
Methoxy			I	cyclo-Propyl			sekButyl			S	0	
Methoxy			I	cyclo-Propyl			tertButyl	_		S	0	

cyclo-Propyl	50	45	40	35	30	25	20 	15	10	*	>	
H Cyclo-Propyl			2	**							-	1
H cyclo-Propyl	, no 4.		I	cyclo-Propy	_		cyclo-Hexy	_		S	0	
H Cyclo-Propyl	, xou		I	cvclo-Propy			Cyclopropy	lmethyl		S	0	
H cyclo-Propyl	thos:		=	cyclo-Propy			Ethoxymeth	ıyı		S	0	
H cyclo-Propyl	rioxy 1 phenoxu		: I	cvelo-Propy			2-Methoxy-	ethoxy-meth	lyl	S	0	
H Cyclo-Propyl	1-ruenos)		: =	cvclo-Propy	_		Benzyloxym	ethyl		S	0	
H cyclo-Propyl	1 - Pilenoxy		: =	cyclo-Propy	-		(4-Bromben	izoyl)-methy	y1	S	0	
H cyclo-Propyl	1-phenox		: I	cvclo-Propy	-		(4-Methoxy	benzoyl)-me	ethy1	S	0	
H cyclo-Propyl	C1-Filenoxy		: I	cvclo-Propy			Phthalimid	lome thy l		S	0	
H cyclo-Propyl Phenyl H cyclo-Propyl	ri-riienoxy		=	cvclo-Propy	_		Methylthio	methy1		S	0	
H cyclo-Propyl Phenyl H cyclo-Propyl	CI-FREROXY		: I	cvclo-Propy	_		2-Thiometh	ıyl-ethyl		S	0	
H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl Phenyl H cyclo-Propyl Phenyl H cyclo-Propyl Phenyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl	on-Incho		: I	cyclo-Propy	_		СН(С ₆ Н ₅)СС	0CH 3		S	0	
H cyclo-Propyl	envithio		I	cyclo-Propy	-		Phenylethy	, , , , , , , , , , , , , , , , , , ,		S	0	
H cyclo-Propyl	envithio		Ξ	cyclo-Pro	y1		4-F-Pheny	ethyl		S	0	
H cyclo-Propyl	envlthio		Ξ	cyclo-Prop	l h		Phthalimic	0		S	0	
H cyclo-Propyl	envithio		I	cyclo-Pro	y1		Tetrahydro	ophthalimido	•	S	Ο.	
H cyclo-Propyl	envithio		I	cyclo-Pro	l ko		Maleinimic	2		S	0	
H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl	enylthio		I	cyclo-Prop	T.		Succinimic	t o		ဟ	0	
H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl	4-(C1.C1)-Pheny		I	cyclo-Prop	-		Piperidimo	•		ဟ	0	
H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl	h_(c] c])_Dhen		I	cvclo-Prop			Li+			S	0	
H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl	4-(C1,C1)-Pheny	. =	I	cyclo-Prop	-		Na+			ဟ	0	
H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl	4-(C1 C1)-Phen	· ~	I	cyclo-Prop	_		+			S	0	
H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl	/		Ι	cyclo-Prop	5		+ * HN			S	0	
H cyclo-Propyl	4-(c1, c1) - phon		Ξ.	cvclo-Prop			Diisopropy	/lammonium		S	0	
	4-(c1, c1)-ruen 4-(c1, c1)-Phen		=	cyclo-Prop	-		2-Hydroxy	ethyl-ammon	m .	S	0	
H cyclo-Propyl	Thiens!		I	cyclo-Prop			Allyl			S.	0	

55	50	4 5	40	35	30	25	20	15	10	5		
12			8 3	R4			RS			*	>	1
											-	
2-Thienvi			Ŧ	cyclo-Propyl			Methallyl			S	O	
2-Thienvl			I	cyclo-Propyl			2-Chlorally	_		S	0	
2-Thienyl			I	cyclo-Propyl			Propargyl			s	0	
2-Thienvl			Ŧ	cyclo-Propyl			3-lodpropargyl	gyl		s	0	
			×	tertButyl			-N=C(CH3)2			S	0	
: L			Ŧ	tertButyl			-N=C(CH3)2			v	0	
. 5			Ŧ	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0	
Methyl			I	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0	
Ethv]			I	tertButyl			-N=C(CH3)2			S	0	
n-Pronv1			I	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0	
teo-Propel	_		I	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0	
150 - 10FJ	•		I	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0	
ico=Butv]			Í	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0	
sot -Butv	-		=	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0	
Jen- Jen-			: I	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0	
cutto-Bronvi	, j i		: =	tertButyl			-N=C(CH3)2			S	0	
cyclo ricky			I	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0	
cyclo Bacy:	.j.		I	tertButyl			-N=C(CH3)2			S	0	
CVC 10-Hexv	. (2)		I	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0	
cyclo nesy:		e ^s	Ξ	tertButyl			-N=C(CH3)2			S	0	
the older			×	tertButvl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0	
cyclo-octyl	Ly:		: =	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0	
I-Metny 10	I-Metnylcyclopropyr		: 3	tert -Butyl			-N=C(CH3)2			S	0	
orications of the contraction of	F F UOFME triy 		: I	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0	
Chlorair	luorine ciry i		: I	tertButyl			-N=C(CH3)2			S	0	
Pentatiuormetnyi	orme triy i		=	, , , , , , , , , , , , , , , , , , , ,								

55	50	45	40	35		30	25	20	15	10	5	
R1			R.3	R4				R5			×	>
1so-Propoxy	ž.		I	tertButy	7		T	-N=C(CH3)2			S	0
Methoxymethyl	thyl		I	tertButy	7		T	-N=C (CH3) 2			S	0
1-Methylm	1-Methylmethoxymethyl	_	Ŧ	tertButy	<u> </u>		Ŧ	-N=C(CH3)2			S	0
1-Methylm	1-Methylmethoxyethyl		I	tertButy	y.		T	-N=C (CH3) 2			S	0
Ethoxymethyl	hyl		I	tertButy	y.		T	-N=C (CH3) 2			S	0
Vinyl	1		I	tertButy	yl		Т	-N=C (CH3) 2			S	0
Allyl			I	tertButy	y		ī	-N=C(CH3)2			တ	0
Methallyl			I	tertButy	y.		ī	-N=C(CH3)2			S	0
Crotyl			Ŧ	tertButy	y.		ī	-N=C (CH3) 2			S	0
Ethinyl			=	tertButy	J.		1	-N=C(CH3)2			S	0
Propargy			Ŧ	tertButy	yl		T	-N=C (CH3) 2			S	0
Phenyleethinyl	hinyl		I	tertButy	yı		T	-N=C (CH3) 2			S	0
Methoxy	•		I	tertButy	yl		T	-N=C(CH3)2			S	0
Ethoxy			÷	tertButy	yl		ī	-N=C (CH3)2			S	0
Trifluormethoxy	ethoxy		I	tertButy	yl		T	-N=C (CH3) 2			S	0
Methy 1 thio			Ŧ	tertButy	y l	-	ī	-N=C (CH3)2			S	0
Trifluorm	Trifluormethylthio		I	tertButy	yl		T	-N=C(CH3)2			s	0
Phenoxy			I	tertButy	yl		T	-N=C (CH3) 2			S	0
4-C1-Phenoxy	OXY		I	tertButy	yl		T	-N=C (CH3) 2			S	0
2, 4-(C1, C	2, 4-(C1, C1)-Phenoxy		=	tertButy	, y 1		ı	-N=C (CH3)2		-	S	
4-CF 3-Phenoxy	noxy		I	tertButy	lų		ı	-N=C (CH3)2		•	S	0
Phenyl	•		I	tertButy	y1		1	-N=C(CH3)2			s	0
2-F-Phenylthio	1thio		I	tertButy	اخ		ı	-N=C (CH3)2			S	0
3-F-Phenyl	-		I	tertButy	.y.		1	-N=C (CH3) 2			S	0
2, 4-(F, F)-Phenyl	-Phenyl		I	tertButy	.y.l		•	-N=C(CH3) ₂			S	0

'5	> ×	-,	o s	o s	0 S	o s	o s	o s	o s	s o	o s	o s	o s	0 S	s 0	o s	o s	o s	0 S	0 S	0 \$	s 0	<i>c</i>					o s
10																												
15			7	2	7	~	~	. 7	~	7	~ ~	. ~	~					. ~					7	2 ,	12) 2) 2) 2
20	RS		-N=C(CH3)	-N=C(CH3)	-N=C(CH3)	-N=C(CH3)	-N=C(CH ₃)	-N=C(CH3)	-N=C(CH ₃)	-N=C(CH ₃)	-N=C(CH3)	-N=C(CH ₃)	-N=C (CH3)	-N=C (CH3)	-N=C(CH3)	-N=C (CH3)	-N=C (CH3)	-N=C(CH3)	-N=C (CH3)	-N=C (CH 2)	-N=C (CH ₃)	-N=C (CH ₂		-N-C (CH3)	-N=C (CH3)	-N=C(CH3	-N=C (CH3)	-N=C (CH3)
25																												
30			7		. 5	. 5		 	. =				·, -			. f.	1631		16.1	10,1	11.31	1 L y 1	1631	utyl	utyl	utyl	utyl	utyl
35	R 4		tertButy	tertButv	tertButv	tert -Buty	tert -Butv	tert -Butv	tertButy	tert -Butv	tort -Butv	tertButy	tert -Butv	tert -Buty	ter t. Buty	tertbuc	tont tont	tertbuty	ter toc	tert, -Buty	tertButy	ter tbuty	tertButy	tertButy	tertButy	tertButy	tertButyl	tertButyl
40	£		I	=	: 3	: 3	: 2		: 3	: a		E 3	= =	: :	E :	: :	Ξ:	= =	E :	= :	= :	Ι.	I	I	I	I	Ι	Ŧ
4 5						nenyı				2, 4- (CH ₃ , CH ₃) -rneny i	13, CH3J-Filet			13)-Pheny I	_		·)-Pheny I						furanyl	furanyl	•		
50			- Lohony	Z-CI-riienyi	ci-Phenyi	2, 4-(C1, C1)-rnenyı	CH 3-Pheny I	3-CH ₃ -Pheny I	CH 3-Pheny I	4- (CH3, CH3)	4, 6- (CH3, Ch	2-CF 3-Phenyl	2-OCH ₃ -Phenyi	4-(0CH3, 0CH	4-0CF 3-Phenyl	-SCH ₃ -Pheny	3-SCF ₃ -Phenyl	4-(NO2, NO2	4-NO ₂ -Pheny l	2-Thienyl	3-Thienyl	2-Furanyl	-Furanyl	2-Tetrahydrofuranyl	3-Tetrahydrofuranyl	2-buridul	-ryidyi	3-Pyridyi 4-Pyridyi
55	7			7 .	ָה קרו	7	7 -7	w .	4	7,	2,	. 2-	-2	2,	4	4	က်	7,	#	7	Ċ.	7	n	7	י רי	, (4 (7

5 10 15	> *		o s o z	0 S 0	0 8	2 0 8) s o s) ₂ s o) ₂ s o) ₂ s o) ₂ s o) ₂ s o	0 s °() ₂ s 0) ₂) ₂ S O) ₂ S O) ₂ s 0) 2 S	2	0 S 2() ₂ s o) ₂	0 8 0	0 8 0	0 8	S
20	RS		-N=C (CH3)	-N=C (CH3)	-N=C (CH ₃	-N=C(CH ₃	-N=C(CH ₃)	-N=C(CH3)	-N=C (CH ₃	-N=C (CH3	-N=C (CH3	-N=C(CH3)	-N×C (CH3)	-N=C(CH ₃	-N=C(CH3)	-N=C(CH3)	-N=C (CH3)	-N=C (CH3)	-N=C(CH3	-N=C (CH3)	-N=C (CH3	-N=C (CH3)	-N=C(CH3	-N=C (CH3	-N=C (CH 1)	-N=C (CH ₂	(E(12)) - N -
30												_	_	_	_	-	_	-	-	_	_		_	_			- 1
35	4		tertButyl	tert -Butvl	tert -Butyl	cvclo-Pronvl	cyclo-Propyl	cvclo-Propyl	cvclo-Propvl	cvclo-Propv	cvclo-Propy	cvclo-Propy	cyclo-Propyl	cyclo-Propy	cyclo-Propy	cyclo-Propy	cyclo-Propy	cyclo-Propy	cyclo-Propy	cyclo-Propy	cvclo-Propv	cvclo-Propv	cvc lo-Propv	ביים סיים ביים	cyclo propi	cyclo-Propy	cyclo-Propy i
40	č	1	1	: 3	: 3	: 2	: I	: =	: I	: =	: I	: =	: =	: =	=	I	.	: =	Ŧ	=	=	= =	: 3	; =	E :	· E :	I
45			[7 4		1 6 11 1	ı kuz																	1,400	oba	•	thyl	
50				z-tecrangaropy, any i	3-Tetranydropyranyı	4-Tetranydropyrany i			•	metnyi	Ethy (n-rropy:	iso-riopy:	n-bucy!	130-Dacy 1	-Butvl	curlo-Browl	o-Butv1	cyclo Bacy:	cyclo renej.	o neal	cyclo-nepty:	cyclo-occy1	I-Merny Icyclopi opy i	Trifluormethyl	Chlordifluormethyl	Pentafluorethyl

50 55	45	40	35	30	25	20	15	10	5	
		0	*			25			×	-
181		2								_
		3	rvrlo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	Ö
Methoxymethyl	•	= =	cyclo richy:			-N=C(CH ₃),			S	0
l-Methylmethoxymethyl	/methyl	E	cyclo-riopy:			-N=C(CHa)a			S	0
1-Methylmethoxyethyl	yethyl	I	cyclo-Propy!			7 (5113) 7			v.	0
Fthoxymethyl		I	cyclo-Propyl			-N=C(CH3) 2			, ,	
inch,		Ξ	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			n (.
viny i		: =	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0
Allyl		: 3	CVC 10-Propy			-N=C(CH3)2			ဟ	0
Methallyl		E :	cyclo-riopy!			-N=C(CH1),			S	0
Crotyl		I	cyclo-riopyi			-N=C(CH3)			S	0
Ethinyl		I	cyclo-Propyl			N-C(CH3) 2			S	0
Propargyl		I	cyclo-Propyl			N=C(CH3) 2			v.	0
Phenylethinyl		I	cyclo-Propyl			-N=C(cn3)2			·	
Methorv		I	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			י נ	
		I	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			n (> (
culdy)	;	=	cvclo-Propvl			-N=C(CH3)2			S	ɔ
Trifluormetnoxy	Ż.	: 3	curlo-Pronvl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
Methylthio	•	: :	cyclo riopy			-N=C(CH3)2			S	0
Trifluormethylthio	l thio					-N=C (CH ₃) 2			s	0
Phenoxy		I	cyclo-Propyl			-N=C (CH3) 2			s	0
4-C1-Phenoxy		I	cyclo-Propyl			2 (CH2) 2 N=N=			S	0
2, 4-(C1, C1)-Phenoxy	henoxy	I	cyclo-Propyl			N-C(CH2) 2			v.	c
4-CF 1-Phenoxy		I	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			, <i>u</i>	
ohonul		I	cyclo-Propyl			-N=C(CH3)2			າ (•
riteny t	(I	cvclo-Propyl			-N=C(CH3)2			n	>
2-F-Pneny Luito	-	: 3	rvrlo-Probyl			-N=C (CH3) 2			S	0
3-F-Pheny I	•	= =	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
2, 4-(F, F)-Pheny I	ı hu	ב ז	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0
2-C1-Phenyl		=								

55	50	45	40	35	30	25	20	15	10	5	
ã			£3	4			ج ت			×	>
											_
3-C1-Phenyl	=		I	cyclo-Propy	yl		-N=C(CH3)2			S	0
2, 4-(C1, C1	1)-Phenyl		I	cyclo-Propy	yı		-N=C(CH3)2			S	0
2-CH ₃ -Phenyl	nyl		I	cyclo-Propy	yl		-N=C(CH ₃) ₂			S	0
3-CH ₃ -Pher	nyl		I	cyclo-Propy	yl		-N=C(CH ₃) ₂			S	0
4-CH3-Pher	4-CH3-Phenyl		×	cyclo-Propy	yl		-N=C(CH3)2			S	0
2, 4-(CH ₃ , (CH3)-Phenyl		×	cyclo-Propy	l y l		-N=C(CH ₃) ₂			S	0
2, 4, 6- (CH	2, 4, 6- (CH3, CH3, CH3)-Phenyl	henyl	Ŧ	cyclo-Propy	y1		-N=C (CH3) 2			S	0
2-CF ₃ -Phenyl	nyl		=	cyclo-Propy	ly		-N=C(CH ₃) ₂			S	0
2-0CH3-Ph	enyl		I	cyclo-Propy	lų		-N=C(CH3)2			S	0
2, 4-(OCH ₃ ,	2, 4-(OCH ₃ , OCH ₃)-Phenyl	1	×	cyclo-Propy	lyl		-N=C(CH ₃) ₂			S	0
4-0CF ₃ -Phenyl	enyl		I	cyclo-Propy	الإن		-N=C(CH3)2			S	0
4-SCH ₃ -Phenyl	enyl		I	cyclo-Propy	ıyı		-N=C(CH ₃) ₂			S	0
3-SCF 3-Ph	enyl		I	cyclo-Propy	ıyı		-N=C (CH3) 2			S	0
2, 4- (NO2, I	2, 4-(NO ₂ , NO ₂)-Phenyl		Ŧ	cyclo-Propy	ıyı		-N=C(CH3)2			S	0
4-N02-Phe	nyl		I	cyclo-Propy	ıyı		-N=C(CH3)2			S	0
2-Thlenyl	•		I	cyclo-Propy	ıyı		-N=C (CH3) 2			S	0
3-Thienyl			I	cyclo-Propy	ly1		-N=C(CH ₃) ₂			S	0
2-Furanyl			I	cyclo-Propy	ly l	•	-N=C(CH ₃) ₂			S	0
3-Furanyl			Ξ	cyclo-Propy	ıyı		-N=C(CH ₃) ₂			S	0
2-Tetrahy	2-Tetrahydrofuranyl		I	cyclo-Propy	ıyı	•	-N=C(CH3)2			S	0
3-Tetrahy	3-Tetrahydrofuranyl		I	cyclo-Propy	ly l		-N=C(CH3)2			s	0
2-Pyridyl			I	cyclo-Propy	y l		-N=C(CH ₃) ₂			s	0
3-Pyridyl			I	cyclo-Propy	ıyı		-N=C(CH ₃) ₂			S	0
4-Pyridyl			I	cyclo-Propy	1 1		-N=C (CH ₃) ₂			s	0
2-Tetrahy	2-Tetrahydropyranyl		Ŧ	cyclo-Propy	y l		-N=C(CH ₃) ₂			S	0

10 15 20 25	R5	-N=C(CH ₃) ₂	-N=C(CH ₃) ₂	=	I	=		F	Ŧ	I	I	I	Ŧ	I	I	=	tyl H	thy! H	=	I	=	exyl H	ylcyclohexyl H	Ξ	=	I
35	R4	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	Methyl	Ethyl	n-Propyl	iso-Propyl	n-Butyl	iso-Butyl	sekButyl	n-Pentyl	2-Pentyl	3-Pentyl	n-Hexyl	2-Hexyl	3-Hexyl	2-Methyl-2-pentyl	cyclo-Propylmethy	cyclo-Butyl	cyclo-Pentyl	cyclo-Hexyl	1-Methylcyclohexyl	3-Trifluormethylcyclohexyl	Allyl	1-Buten-3-yl	Crotyl
40	R3	I	I	I	.	Ŧ	I	±	I	Ŧ	I	I	I	Ŧ	÷	I	I	x	I	I	Ξ	I	I	I	Ξ	I
4 5		nyl	ny l	•																						
		3-Tetrahydropyranyl	4-Tetrahydropyranyl	2												1so-Propyl	so-Propyl	so-Propy	so-Propyl	SO-Propy	Iso-Propyl	cvclo-Propvl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl

50 55	45	40	35	30	25	20	. 15	10	5	
R1		82	8		S S				*	>
cyclo-Propyl		I	Propargyl		Ŧ				S	0
Allyl		I	1-Butin-3-yl		I				S	0
Allyl		I	3-Methyl-1-butin-3-yl	In-3-y1	I				s	0
Allyl		I	2-Pentin-4-yl		Ŧ			•	s	0
Allyl		I	Benzyl		Ξ				S	0
Allyl		I	2-Phenylethyl		Ŧ				s	0
Allyl		I	2-Methylthioethyl	1 1 1	I				S	0
Ethinyl	٠	I	2-Chlorethyl		=				S	0
Ethinyl		Ŧ	2-Methoxyethyl		I				S	0
Ethinyl		I	2-(N, N-Dimethylamino)ethyl	lamino)ethyl	I		•		S	0
Ethinyl		I	Phenyl		I				S	0
Ethinyl		Ŧ	2-CH ₃ -Phenyl		I				S	0
Ethinyl		I	4-CH ₃ -Phenyl		Ξ				S	0
Methoxy		I	2, 4-(CH ₃ , CH ₃)-Phenyl	henyl	I				s	0
Methoxy		I	2, 3, 5-(CH ₃ , CH ₃ , CH ₃)-Pheny	, CH ₃)-Phenyl	I				s	0
Methoxy		I	3-CF ₃ -Phenyl		I				S	0
Methoxy		I	3-F-Phenyl		I				s	0
Methoxy		I	2-C1-Phenyl		I				S	0
Methoxy		Ξ	4-Cl-Phenyl		I				s	0
4-Cl-Phenoxy	>	I	2, 4-(F, F)-Phenyl	7	Ŧ				s	· 0
4-C1-Phenoxy	. >	I	2, 3, 5-(c1, c1, c1)-Pheny ¹	l)-Phenyl	I				S	0
4-Cl-Phenoxy	. >-	Ŧ	2-CN-Pheny1		I				s	0
4-C1-Phenoxy	. >	I	2-OCH ₃ -Phenyl		Ξ				S	0
4-Cl-Phenoxy	· >-	I	2, 3-(OCH ₃ , OCH ₃)-Phenyl)-Phenyl	I				s	0
4-C1-Phenoxy	رخ	Ξ	3, 4, 5-(OCH ₃ , OCH ₃ , OCH ₃)-Phenyl	н ₃ , осн ₃) -Рћеп	1 H				S	0

55	50	45	40		35	30	· 25	20	15	10	5	
RI			R3	R4			R5				×	_
												_
Phenylthio			Ŧ	3-0CF3	3-0CF 3-Phenyl		I				S	0
Phenylthlo			I	4-0CF 2	4-OCF 2CHF 2-Phenyl	yı	I				s	0
Pheny 1 thio			I	2-SCH ₃	2-SCH ₃ -Phenyl		Ŧ				S	0
Pheny 1 thio			I	2, 4-(S	2, 4-(SCH3, SCH3)-Pheny1	-Phenyl	I				S	0
Pheny I thio			I	2-SCF 3	2-SCF 3-Pheny1		I				S	0
Pheny 1 thio			I	4-NO2-	4-NO ₂ -Phenyl		I				s	0
2, 4-(C1, C1)-Pheny)-Phenyl		I	2, 4-(N	2, 4-(NO ₂ , NO ₂)-Phenyl	heny l	I				S	0
2, 4-(C1, C1)-Phenyl)-Phenyl		Ŧ	2-сно-	2-CHO-Pheny l		I				S	0
2,4-(01,01)-Phenyl		I	3-COCH	3-COCH ₃ -Phenyl		I				S	0
2,4-(01,01)-Phenyl		I	3-COCF	3-COCF ₃ -Phenyl		I				S	0
2, 4-(01,01)-Phenyl		±	1-Naphthy1	ıthyl		I				S	0
2, 4-(01,01)-Phenyl		Ŧ	2-Naphthyl	ıthyl		¥				S	0
2-Thienyl			I	Piperidino	dino		I				S	0
2-Thienyl			I	3-Tetr	3-Tetrahydrofuranyl	anyl	I				s	0
2-Thienyl			I	4-Tetr	4-Tetrahydropyranyl	any 1	I				s	0
2-Thlenyl			I	2-Thiazolyl	lyloze		Ξ				S	0
2-Thienyl			I	5-сн3-	5-CH ₃ -2-Thiazolyl	yl	I				S	0
2-Thlenyl			I	4-CH3-	4-CH3-5-C00H-2-Thiazolyl	Thiazolyl	I				S	0
3-Pyridyl			Ĩ	Methyl	•		I				S	0
3-Pyridyl			I	Ethyl			I				S	0
3-Pyridyl			I	n-Propy	oy l		I				s	0
3-Pyridyl			I	iso-Propyl	ropyl		Ξ				s	0
3-Pyridyl	•		Ξ	n-Butyl	٧.		I				S	0
3-Pyridyl			Ξ	i so-Bı	iso-Butylyl		Ŧ				s	0
iso-Propyl	_		Methyl	sekButyl	Butyl		=				S	0

R3 Methyl Methyl	~		* * * * * *		× 0000	>0000
Methy!	_		· ·		, v, v	000
Methyl H	yl 3-Hexyl Methyl		-N=C(CH ₃) ₂		, w	0
I	Ethyl n-Probvl		-N=C(CH ₃) ₂ -N=C(CH ₃) ₂		က ဟ	0 0
: :	iso-Propyl		-N=C(CH ₃) ₂		S C	0
I I	n-Butyl iso-Butyl		-N=C(CH3)2 -N=C(CH3)2		n n	0
	sekButyl		-N=C(CH ₃) ₂		ν n	0 0
I I	n-Pentyl 2-Pentyl		-N=C(CH3)2 -N=C(CH3)2		ָא ח	0
I	3-Pentyl		-N=C(CH ₃) ₂		ဟ	0
I	n-Hexyl		-N=C(CH ₃) ₂		S	0
I	2-Hexyl		-N=C(CH3)2		ဟ ်	0
I	3-Hexyl		-N=C(CH3)2		ဟ	0
I	2-Methyl-2-pentyl	tyl	-N=C(CH ₃) ₂		S	0
I	cyclo-Proplymethy	thyl	-N=C(CH3)2		S	0
I	cyclo-Butyl		-N=C(CH3)2		S	0
I	cyclo-Pentyl		-N=C(CH3)2		S	0
I	cyclo-Hexyl		-N=C (CH3) 2		S	0
I	1-Methylcyclohexyl	ехуј	-N=C(CH ₃) ₂		κ	0

50 55	45	40	35	30	25	20	15	10		5	
R.1		R3	R4			R5			*	-	
			·							-	
cyclo-Propyl		I	3-Trifluormet	3-Trifluormethylcyclohexyl	•	-N=C(CH3)2			S	0	
cvclo-Propyl		I	Allyl		•	-N=C(CH3)2			S	0	
cvclo-Probvl		I	1-Buten-3-yl		Ť	-N=C(CH3)2			S	0	
cvclo-Propvl		I	Crotyl		·	-N=C (CH3) 2			S	0	
cyclo-Propyl		I	Propargyl		·	-N=C(CH3)2			S	0	
Allyl		=	1-Butin-3-yl			-N=C(CH3)2			S	0	
Allyl		I	3-Methyl-1-butin-3-y	tin-3-yl		-N=C (CH3) 2			S	0	
Allyl		I	2-Pentin-4-yl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0	
Allyl		I	Benzyl			-N=C(CH3)2			S	0	
Allyl		I	2-Phenylethyl			-N=C(CH3)2			S	0	
A11v1		Ξ	2-Methylthioethyl	thyl		-N=C(CH3)2			S	0	
Ethinvi		I	2-Chlorethyl	,		-N≖C (CH3) 2			S	0	
Ethiny		I	2-Methoxyethyl	_		-N=C(CH3)2			S	0	
Ethiny		I	2-(n, N-Dimeth	2-(n, N-Dimethylamino)ethyl		-N=C(CH ₃) ₂			S	0	
Ethinyl		I	Phenyl			-N=C(CH3)2			S	0	
Ethinyl		I	2-CH ₃ -Pheny l			-N=C(CH3)2			S	0	
Ethinyl		I	4-CH3-Phenyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0	
Methoxy		I	2, 4-{CH ₃ , CH ₃ }-Phenyl	-Pheny l		-N=C(CH3)2			S	0	
Methoxy		I	2, 3, 5-(CH ₃ , CH	2, 3, 5-(CH ₃ , CH ₃ , CH ₃)-Pheny l		-N=C(CH ₃) ₂			S	0	
Methoxy		=	3-CF3-Phenyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0	
to the state of th		I	3-F-Phenyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0	
Methoxy		Ι	2-C1-Phenyl			-N=C(CH3)2			S	0	
Methoxy		I	4-C1-Phenyl			-N=C(CH3)2			S	0	
4-C1-Phenoxy		I	2, 4-(F,F)-Phenyl	enyl		-N=C (CH ₃) ₂			S	0	
4-C1-Phenoxy		I	2, 3, 5-(C1, C1, C1)-Phenyl	.cl)-Phenyl		-N=C (CH ₃) ₂			S	0	
function to the											

55	. 50	45	40 .	35	30	25	20	15	10	5	
R 1			2	75 ¢			RS			×	>
	<u>.</u>		:	200						·	- 6
4-CI-Pnenoxy	^		E	7-ru-kieuž I	_		-N=C(CH3)2			n	>
4-Cl-Phenoxy	<u>.</u>		I	2-0CH ₃ -Pheny 1	nyl		-N=C(CH3)2			S	0
4-C1-Phenoxy	Į,		I	2, 3-(0CH ₃ ,	2, 3-(OCH ₃ , OCH ₃)-Phenyl		-N=C (CH3) 2			S	0
4-C1-Phenoxy	Į,		I	3, 4, 5- (осн	3, 4, 5~(OCH ₃ , OCH ₃ , OCH ₃)-Pheny 1	eny 1	-N=C (CH3) 2			S	0
Phenylthio			Ŧ	3-0CF ₃ -Phenyl	lyl		-N=C (CH3) 2			S	0
Phenylthio		···.	I	4-OCF ₂ CHF ₂ -Phenyl	-Phenyl		-N=C (CH3) 2			S	0
Phenylthio			I	2-SCH ₃ -Pheny1	nyl		-N=C (CH3) 2			S	0
Phenylthio			I	2, 4- (SCH ₃ ,	2, 4-(SCH ₃ , SCH ₃)-Phenyl		-N=C (CH3) 2			S	0
Phenylthio			=	2-SCF ₃ -Phenyl	nyl		-N=C (CH3) 2			S	0
Phenylthio			Ŧ	4-NO ₂ -Phenyl	ıyı		-N=C(CH3)2			S	0
2, 4-(C1, C1)-Phenyl	-Phenyl		I	2, 4- (NO ₂ , N	2, 4-(NO ₂ , NO ₂)-Phenyl		-N=C (CH3) 2			s	0
2, 4-(C1, C1)-Phenyl	-Phenyl		Ŧ	2-CHO-Phenyl	ıyı		-N=C (CH3) 2			S	0
2, 4-(C1, C1)-Pheny	-Pheny		Ŧ	3-COCH ₃ -Pheny l	enyl		-N=C (CH3) 2			S	0
2, 4-(C1, C1)-Pheny	-Phenyl		π̈	3-cocF ₃ -Phenyl	enyl		-N=C (CH3) 2			S	0
2, 4-(C1, C1)-Pheny	-Phenyl		Ŧ	1-Naphthyl			-N=C (CH3) 2			S	0
2, 4-(C1, C1)-Pheny	-Pheny		Ŧ	2-Naphthyl			-N=C (CH3) 2			S	0
2-Thienyl			I	Piperidinyl			-N=C (CH3) 2			S	0
2-Thienyl			Ŧ	3-Tetrahydrofuranyl	Irofuranyl		-N=C(CH ₃) ₂			S	0
2-Thienyl			×	4-Tetrahydropyranyl	ropyranyl		-N=C (CH3) 2			S	0
2-Thienyl			I	2-Thiazolyl	_		-N=C (CH3) 2			S	0
2-Thienyl			I	5-CH ₃ -2-Thiazolyl	iazolyl		-N=C(CH3)2			S	0
2-Thienyl			I	4-CH3-5-CO	4-CH ₃ -5-COOH-2-Thiazolyl		-N=C(CH ₃) ₂			S	0
3-Pyridyl			I	Methyl			-N=C (CH3) 2			S	0
3-Pyridyl			I	Ethyl			-N=C (CH3) 2			S	0
3-Pyridyl			I	n-Propyl			-N=C(CH3)2			S	0

H 150-Propy	50	4 5	40	35	30	25	20	15	10	5		
H	R1			R4			RS			×	-	
H 150-Propy										1	-	
H n-Buty	3-Pyridy1		I	iso-Propyl			-N=C(CH3)3			S	0	
H	3-Pvridvl		I	n-Butyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0	
	3-byridy]		=	iso-Butyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0	
Nethyl N	1co-Browl		Methvl	sekButyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0	
opyl Methyl 2-Pentyl -N=C(CH3)2 S opyl Methyl 2-Pentyl -N=C(CH3)2 S opyl Methyl 2-Pentyl N=C(CH3)2 S opyl Methyl 2-Hexyl N=C(CH3)2 S opyl Methyl 2-Hexyl S S der Butyl 2-A-(CL,CL)-Phenyl S S der tertButyl Ethyl S S h tertButyl tertButyl S S enyl H tertButyl Cf.Cl,Cl)-Phenyl S enyl H tertButyl A-F-Phenyl S enyl H tertButyl Cf.Cl,Cl)-Phenyl S enyl H tertButyl Cf.Cl,Cl)-Phenyl S	1so-Propy		Methyl	n-Pentyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0	
Oppy! Methy! 3-Penty! -N=C(CH3)2 S Opy! Methy! 2-Hexy! -N=C(CH3)2 S Opy! Methy! 2-Hexy! S S Opy! Methy! 2-Hexy! S S Opy! Methy! 2-Hexy! S S H tertButy! Ethy! S S H tertButy! Buty! S S H tertButy! Pheny! S S H tertButy! 4-F-Pheny! S S H tertButy! 2-4-(CI.CI)-Pheny! S S H tertButy! 4-F-Pheny! S S H tertButy! 2-4-(CI.CI)-Pheny! S S H tertButy! 4-F-Pheny! S S Opy! H tertButy! S S Opy! H tertButy! S S Opy! H te	iso-Fropy		Methvl	2-Pentyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0	
Opyl Methyl n-Hexyl -N=C(CH3)2 S Opyl Methyl 2-Hexyl -N=C(CH3)2 S S Opyl Methyl 2-Hexyl -N=C(CH3)2 S S S S S S S C C(CH3)2 S	iso-Propy)	•	Methyl	3-Pentyl			-N=C(CH ₃) ₂			S	0	
opy1 Methy1 2-Hexy1 -N=C(CH3)2 S opy1 Methy1 2-Hexy1 S S H tertButy1 2,4-(CI,CI)-Pheny1 S S H tertButy1 2-Pyridy1 S S H tertButy1 Ethy1 S S H tertButy1 HertButy1 S S H tertButy1 4-Feheny1 S S H tertButy1 4-Feheny1 S S H tertButy1 2,4-(CI,CI)-Pheny1 S S H tertButy1 4-Feheny1 S S Opy1 H tertButy1 2,4-(CI,CI)-Pheny1 S Opy1 H tertButy1 A-Februy1 S Opy1 H tertButy1 Buty1 S Opy1 H tertButy1 S S Opy1 H tertButy1 Buty1 S Opy2	iso-Propy)	_	Methyl	n-Hexy1			-N=C (CH3) 2			S	0	
opy1 Nethy1 3-Hexy1 -N=C(CH3)2 S opy1 H tertButy1 2,4-(Cl,Cl)-Pheny1 S H tertButy1 Ethy1 S H tertButy1 Buty1 S H tertButy1 Pheny1 S H tertButy1 4-F-Pheny1 S eeny1 H tertButy1 3-CF3-Pheny1 S eeny1 H tertButy1 2,4-(Cl,Cl)-Pheny1 S eopy1 H tertButy1 S eopy1 H tertButy1 S eopy1 H tertButy1 Ethy1 eopy1 H tertButy1 Buty1 eopy1 H tertButy1 S eopy1 H <td>iso-Propy1</td> <td></td> <td>Methy!</td> <td>2-Hexyl</td> <td></td> <td></td> <td>-N=C (CH3)2</td> <td></td> <td></td> <td>S</td> <td>0</td> <td></td>	iso-Propy1		Methy!	2-Hexyl			-N=C (CH3)2			S	0	
H tertButy 2,4-(CI,CI)-Pheny 5 H tertButy Ethy 1 H tertButy Buty Buty H tertButy Buty Ethy S H tertButy Pheny S H tertButy 4-F-Pheny S H tertButy 3-CF_3-Pheny S Opy H tertButy 2,4-(CI,CI)-Pheny S Opy H tertButy Ethy S Opy H tertButy Buty S	Iso-Propyl	_	Methyl	3-Hexy1			-N=C (CH3) 2			လ	0	
H tertButyl 2-Pyridyl S H tertButyl iso-Propyl S H tertButyl Butyl S H tertButyl tertButyl S H tertButyl 4-F-Phenyl S H tertButyl 2,4-(C1,C1)-Phenyl S opyl H tertButyl 2-Pyridyl S opyl H tertButyl S S ropyl H tertButyl Ethyl S ropyl H tertButyl S S ropyl H tertButyl S S ropyl H tertButyl Butyl S ropyl H tertButyl S ropyl H tertButyl	Methyl		· =	tertButyl			2, 4- (C1, C1)-	Pheny1		s	S	
Ethyl Ethyl S H tertButyl Butyl S H tertButyl tertButyl S enyl H tertButyl S enyl H tertButyl A-F-Phenyl S opyl H tertButyl 2,4-(C1,C1)-Phenyl S opyl H tertButyl Bethyl S ropyl H tertButyl Bethyl S ropyl H tertButyl S S ropyl H tertButyl Butyl S ropyl H tertButyl Butyl S	Methyl		I	tertButyl			2-Pyridyl			S	S	
H	Methyl		I	tertButyl			Ethyl			s	S	
H tertButyl EertButyl S emyl H tertButyl S emyl H tertButyl 4-F-Phenyl S emyl H tertButyl 2,4-(Cl,Cl)-Phenyl S opyl H tertButyl S S opyl H tertButyl S S ropyl H tertButyl Butyl S	Mothy]		I	tertButyl			iso-Propyl			s	s	
enyltertButyltertButylnenyl4-F-Phenyl5senyl4-F-Phenyl5opyl4-F-Phenyl5opyl4-F-Phenyl5opyl4-F-Phenyl5opyl4-F-Phenyl5opyl4-F-Phenyl5ropyl4-F-Phenyl5ropyl4-F-Phenyl5ropyl4-F-Putyl5ropyl4-F-Putyl5ropyl4-F-Putyl5ropyl4-F-F-Butyl5ropyl4-F-F-Butyl6ropyl4-F-Putyl8	Methy]		I	tertButyl			Butyl			s	S	
enyl Phenyl S enyl H tertButyl 4-F-Phenyl S enyl H tertButyl 2,4-(Cl,Cl)-Phenyl S opyl H tertButyl S S opyl H tertButyl Butyl S	Kethy]		I	tertButyl			tertButyl			s	S	
enyl 4-F-Phenyl S enyl H tertButyl 3-CF_3-Phenyl S opyl H tertButyl 2-Pyridyl S opyl H tertButyl Butyl S	Methyl		I	tertButyl			Phenyl			S	S	
H tertButyl 3-CF ₃ -Phenyl S H tertButyl 2,4-(Cl,Cl)-Phenyl S H tertButyl Aethyl S H tertButyl Ethyl S H tertButyl S H tertButyl S H tertButyl S H tertButyl S S H tertButyl S S S S S S S S S S S S S S S S S S S	iso-Phenvl		I	tertButyl			4-F-Phenyl			S	s	
H tertButyl 2,4-(C1,C1)-Phenyl S H tertButyl Methyl S H tertButyl Ethyl S H tertButyl iso-Propyl S H tertButyl S	isa-phenyl		Ξ	tertButyl			3-CF ₃ -Pheny			S	S	
H tertButyl 2-Pyridyl S H tertButyl Ethyl H tertButyl iso-Propyl S H tertButyl S	150-Pronv1		I	tertButyl			2, 4-(C1, C1)-	-Phenyl		S	s,	
H tertButyl Ethyl S H tertButyl iso-Propyl S H tertButyl Butyl S	iso-Pronv)		I	tertButyl			2-Pyridyl			S	S	
H tertButyl start. S H tertButyl Butyl S	tso-Pronvl		I	tertButyl			Methyl			S	S	
H tertButyl iso-Propyl S H tertButyl Butyl	iso-Pronvi		I	tertButyl			Ethyl			S	S	
H tertButyl Butyl S	iso-Pronvi		I	tertButyl			iso-Propyl			S	S	
	rvrlo-Pronvl		I	tertButyl			Butyl			S	S	

50 55	45	40	35	30	25	20	16	10	5	
£		æ	*			R5			×	*
								BV		_
cyclo-Propyl		I	tertButyl			tertButyl			S	S
cyclo-Propyl		Ŧ	tertButyl			Pheny l			s	S
cyclo-Propyl		I	tertButyl			4-F-Phenyl			S	S
cyclo-Propyl		I	tertButyl			3-CF ₃ -Phenyl			s	s
cyclo-Propyl		I	tertButyl			2, 4-(Cl, Cl)-Phenyl	nenyl		s	s
cyclo-Propyl		I	tertButyl			2-Pyridyl			s	s
Allyl		I	tertButyl		<i>,-</i>	Methyl			s	S
Ally		I	tertButyl			Ethyl			s	s
Ally		Ŧ	tertButyl		٠	iso-Propyl			S	S
Allyl		I	tertButyl			Butyl			s	S
Allyl		x	tertButyl			tertButyl			S	S
Allyl		I	tertButyl			Pheny1			S	S
Methoxy		I	tertButyl	•		Methyl			S	S
Methoxy		I	tertButyl			Ethyl			S	S
Methoxy		Ξ	tertButyl			iso-Propyl			vs	s
Methoxy		I	tertButyl			Butyl			S	S
Methoxy		I	tertButyl			tertButyl			S	s
Methoxy		I	tertButyl			Pheny l			S	s
Methoxy		I	tertButyl			4-F-Pheny l			S	S
4-C1-Phenoxy		I	tertButyl			3-CF ₃ -Phenyl			s	S
4-C1-Phenoxy		I	tertButyl			2, 4-(C1, C1)-Pheny	ieny l		s	S
4-C1-Phenoxy		I	tertButyl			2-Pyridyl			S	S
4-C1-Phenoxy		I	tertButyl			Methyl			S	S
4-C1-Phenoxy		Ŧ	tertButyl			Ethyl			s	s
4-Cl-Phenoxy		I	tertButyl			iso-Propyl			S	S

50	45	40	40	35	30	25	20	15	10	5	
R1		83	R4				RS			×	-
		2	***************************************	[2+6]			But v 1			v	_ o
4-CI-FIERRAS		: 3	+ort -Butv	auty!			tertRutvl			S	
2,4-(c1,c1)-rheny		: 3	+ort -Bet				Phenyl			S	· v
2,4-(c1,c1)-rheny (, j	5 3	+ert -Buty	מרקור מודעו			4-F-Phenyl			ဟ	, v
2,4-(c1,c1)-Fileny	֓֞֜֝֓֓֓֓֓֓֓֓֓֓֓֓֓֓֓֓֓֓֓֓֓֓֓֓֓֓֓֓֓֓֓֓֓֓֡֓֓֓֡֓֡	: =	tertButv	Butvi			3-CF ₃ -Phenyl			S	ဟ
2.4-(C1.C1) -Pheny	 ! \r	: I	tertButy	Butyl			2, 4-(cl, cl)-Phenyl	henyl		S	S
2, 4-(C1, C1)-Pheny	ıyı	I	tertButy	Butyl			2-Pyridyl			S	S
2, 4-(C1, C1) -Pheny	ıy l	I	tertButyl	Butyl			Ethyl			S	S
2-Thlenyl	,	Ŧ	tertButy	Butyl			iso-Propyl			S	S
2-Thienyl		I	tertButy	Butyl			Butyl			S	S
2-Thienyl		I	tertButyl	Butyl			tertButyl			S	S
3-Pyridyl		I	tertButyl	Butyl			Phenyl			S	s
3-Pyridyl		I	tertButy	Butyl			4-F-Phenyl			S	s
3-Pyridyl		I	tertButy	Butyl			3-CF 3-Phenyl			S	S
Methyl		I	cyclo-	cyclo-Propyl			2, 4-(C1, C1)-Pheny1	henyl		S	S
Methyl		x	cyclo-	cyclo-Propyl			2-Pyridyl			S	S
Methyl		I	cyclo-	cyclo-Propyl			Ethyl			S	S
Methyl		Ŧ	cyclo-	cyclo-Propyl			iso-Propyl			S	s
Methyl		Ξ	cyc 10-	cyclo-Propyl			Butyl			S	S
Methyl		I	cyclo-	cyclo-Propyl			tertButyl			S	S
Methyl		Ξ	cyclo-	cyclo-Propyl			Pheny1			S	S
1so-Propy 1		I	cyclo-	cyclo-Propyl			4-F-Phenyl			S	s
iso-Proply		I	cyclo-	cyclo-Propyl			3-CF ₃ -Pheny l			S	s
iso-Propyl		Ξ	cyclo-	cyclo-Propyl			2, 4-(Cl, Cl)-Phenyl	henyl		S	s
iso-Propyl		Ξ	cyc 10-	cyclo-Propyl			2-Pyridyl			S	S

150-Propy H Cyclo-Propy Methy Ethy 150-Propy H Cyclo-Propy Ethy 150-Propy Ethy 150-Propy Ethy 150-Propy 15	50 55	45	40	35	30	25	20	15	10	5		
io-Propyl io-Propyl H cyclo-Propyl clo-Propyl H cyclo-Propyl clo-Propyl H cyclo-Propyl clo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl clo-Propyl H cyclo-Propyl Cyclo-Propyl H cyclo-Propyl Cyclo-Propyl H cyclo-Propyl C-Cl-Phenoxy H cyclo-Propyl C-Cl-Phenoxy H cyclo-Propyl C-Cl-Phenoxy H cyclo-Propyl												
H Cyclo-Propyl	R1		R3	R4			R5			×	-	
H Cyclo-Propyl											-	
H Cyclo-Propyl	iso-Propy1		I	cyclo-Propyl			Methyl			S	·v	
H	iso-Propyl		I	cyclo-Propyl			Ethyl			S	s	
H Cyclo-Propyl	iso-Propyl		I	cyclo-Propyl			iso-Propyl			S	S	
H cyclo-Propyl	cvclo-Propvl		Ŧ	cyclo-Propyl			Butyl			S	S	
H Cyclo-Propyl	cyclo-Propyl		I	cyclo-Propyl			tertButyl			S	s	
-propyl H cyclo-Propyl -propyl H cyclo-Propyl -propyl H cyclo-Propyl -propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl xxy H cyclo-Propyl xy H	cvclo-Propvl		I	cyclo-Propyl			Phenyl			S	s	
-Propyl H cyclo-Propyl -Propyl H cyclo-Propyl -Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl XX H cyclo-Propyl XY H cyclo-Propyl YY YY Cyclo-Propyl YY YY YY YY YY YY YY YY YY YY YY YY	cvclo-Propyl		I	cyclo-Propyl			4-F-Phenyl			s	S	
-Propyl H cyclo-Propyl -Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl XX H cyclo-Propyl Phenoxy H cyclo-Propyl -Phenoxy H cyclo-Propyl	cvclo-Propvl		I	cyclo-Propyl			3-CF ₃ -Phenyl			S	S	
-Propyl H	cvclo-Propvl		I	cyclo-Propyl			2, 4-(c1, c1)-P	henyl		S	S	
H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl XX H cyclo-Propyl	cvelo-Propvl		I	cyclo-Propyl			2-Pyridyl			S	S	
H Cyclo-Propyl H Cyclo-Propyl H Cyclo-Propyl H Cyclo-Propyl XY H Cyclo-Propyl XX H Cyclo-Propyl	Allvl		I	cyclo-Propyl			Methyl			S	S	
H Cyclo-Propyl H Cyclo-Propyl H Cyclo-Propyl XX H Cyclo-Propyl	Allvl		I	cyclo-Propyl			Ethyl	•		S	S	
H Cyclo-Propyl H Cyclo-Propyl M Cyclo-Propyl H Cyclo-Propyl H Cyclo-Propyl H Cyclo-Propyl H Cyclo-Propyl H Cyclo-Propyl M Cyclo-Propyl	A11v1		I	cyclo-Propyl			iso-Propyl			S	s	
xy H cyclo-Propyl Phenoxy H cyclo-Propyl	N N		I	cyclo-Propyl			Butyl			S	s	
xy H cyclo-Propyl Phenoxy H cyclo-Propyl Phenoxy H cyclo-Propyl	Allyl		Ξ	cyclo-Propyl			tertButyl			S	s	
xy H cyclo-Propyl Phenoxy H cyclo-Propyl Phenoxy H cyclo-Propyl	Allvi		I	cyclo-Propyl			Pheny l			S	s	
H Cyclo-Propyl	Methoxy		I	cyclo-Propyl			Methyl			S	s	
H Cyclo-Propyl	Methoxy		I	cyclo-Propyl			Ethy1			S	S	
H Cyclo-Propyl H Cyclo-Propyl H Cyclo-Propyl H Cyclo-Propyl H Cyclo-Propyl H Cyclo-Propyl	Methoxy		I	cyclo-Propyl			iso-Propyl			S	S	
H Cyclo-Propyl H Cyclo-Propyl H Cyclo-Propyl IENOXY H Cyclo-Propyl	Methoxy		Ξ	cyclo-Propyl			Butyl			S	S	
H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl lenoxy H cyclo-Propyl enoxy H cyclo-Propyl	Methoxy		I	cyclo-Propyl			tertButyl			S	s	
H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl enoxy H cyclo-Propyl	Methoxy		Ι	cyclo-Propyl			Phenyl			s	s	
enoxy H cyclo-Propyl enoxy H cyclo-Propyl	Mothoxy		: =	cvclo-Propyl			4-F-Phenyl			s	s	
H cyclo-Propyl	4-C1-Phenoxy		Ξ	cyclo-Propyl			3-CF ₃ -Phenyl			s	S	
	4-C1-Phenoxy		Ξ	cyclo-Propyl			2, 4-(c1, c1)-P	henyl		S	S	

R1 4-C1-Phenoxy 4-C1-Phenoxy 7-C1-Phenoxy	æ III	cyclo-Propyl cyclo-Propyl		R5 2-Pyridyl Methyl Ethyl		× 000	> v.v.v
J-Cl-Phenoxy F-Cl-Phenoxy F-Cl-Phenoxy S-Cl-Cl,Cl,Cl,Cl	.	cyclo-propyl cyclo-propyl cyclo-propyl cyclo-propyl		iso-Propyl Butyl tertButyl		, w w w	เพ่พ
2, 4-(c1, c1)-Phenyl 2, 4-(c1, c1)-Phenyl 2, 4-(c1, c1)-Phenyl 2, 4-(c1, c1)-Phenyl	= = =	cyclo-Propyl cyclo-Propyl cyclo-Propyl cyclo-Propyl		Phenyl 4-F-Phenyl 3-CF ₃ -Phenyl 2,4-(Cl,Cl)-Phenyl	=	~ ~ ~ ~ ~	ග ග ග ග
2, 4-(Cl, Cl)-Phenyl 2, 4-(Cl, Cl)-Phenyl 2-Thienyl 2-Thienyl	## #	cyclo-Propyl cyclo-Propyl cyclo-Propyl		2-Pyridyl Ethyl iso-Propyl Butyl		, , , , , ,	~~~~
2-Thienyl 3-Pyridyl 3-Pyridyl 3-Pyridyl	= = = =	cyclo-Propyl cyclo-Propyl cyclo-Propyl cyclo-Propyl		tertButyl Phenyl 4-F-Phenyl 3-CF ₃ -Phenyl 4-Hydroxy-2-butinyl	l Ai	, , , , , , , , , , , , , , , , , , ,	, , , , , , , , , , , , , , , , , , ,
Chlor Chlor Chlor Chlor Chlor	** ***	tertButyl tertButyl tertButyl tertButyl tertButyl		N=C(C ₂ H ₅) ₂ N=C(cyclo-C ₃ H ₅) ₂ 2-Butanimino Cyclohexanimino Cyclooctanimino N=CH-C ₆ H ₅	·		00000

H								
H tertButyl 2-Furyl-methanimino CH2CH2N(CH3)2 H tertButyl CH2CH2N(CH3)2 H tertButyl CH2CH2N TertButyl CH2CH2N TertButyl CH2CH3 TertButyl CH2CH3 Topyl H tertButyl CH3CHC2H3 Topyl H tertButyl CH3CHC3 Topyl H tertButyl CA-Formyl-methyl Topyl H tertButyl CA-Formyl Topyl H tertButyl To	-	R3	R4		RS		×	>
HertButy CH2CH2M(CH3) 2		3	+ + + + + + + + + + + + + + + + + + +		2-Furvl-methanimino		0	<u></u>
HertButy CH5CHAN [†] (CH3)31 ⁻	etny i	: 3	tert -Butyl		CH CH N (CH 1) 2		0	0
H tertButy CH2CH3C	letny i lethy 1	: =	tertButvl		CH,CH,N+(CH3)317		0	0
TertButy CH2CH2CN	letny i	: 3	+ort -Butv1		CH 1CF 1		0	0
opp1 H tertButy1 CH2CH2CN opp1 H tertButy1 CH2CH3S1(CH3)3 0 opp1 H tertButy1 CH2CH2S1(CH3)3 0 opp1 H tertButy1 CH2CH2CNH=C(CH3)2 0 opp1 H tertButy1 CH2CH2CNH=C(CH3)2 0 opp1 H tertButy1 CH2CNON(C2H5)2 0 copy1 H tertButy1 2.4-(CL).CI)-Benzy1 0 propy1 H tertButy1 2.4-(CI,CI)-Benzy1 0 propy1 H tertButy1 2-Thieny1-methy1 0 propy1 H tertButy1 2-Trifidy1-methy1 0 propy1 H tertButy1 2-Furany1-methy1 0 propy1 H tertButy1 2-Furany1-methy1 0 propy1 H tertButy1 2-Furany1-methy1 0 propy1 H tertButy1 2-No2-4-F-Pheny1 0 H tertButy1 <	letny i	: =	tert -Butyl		CH,CH,C1		0	0
opp1 H tertButy1 CH2CCI3 opp1 H tertButy1 CH2CH5SI(CH3)3 0 opp1 H tertButy1 CH2CHGO-M=C(CH3)2 0 opp1 H tertButy1 CH2PO(GC2H5)2 0 opp1 H tertButy1 CH2CON(C2H5)2 0 opp1 H tertButy1 CH2CON(C2H5)2 0 opp1 H tertButy1 2.4-(C1,C1)-Benzy1 0 propy1 H tertButy1 2.4-(C1,C1)-Benzy1 0 propy1 H tertButy1 2-Thieny1-methy1 0 propy1 H tertButy1 2-Trifulurmethy1 0 propy1 H tertButy1 2-Propy1 0 H tertButy1 2-Propy1 4-F-Pheny1 0 H tertButy1 2-No2-4-F-Pheny1 0 H tertButy1 2-No2-4-F-Pheny1 0 H tertButy1 3-G(CF3,CF3)-Pheny1 0	ecny (: =	tertButyl		CH ₂ CH ₂ CN		0	0
H tertButyl CH2CH2SI(CH3)3 H tertButyl CH2CH2O-N=C(CH3)2 H tertButyl CH2PO(0C2HS)2 H tertButyl CH2PO(0C2HS)2 H tertButyl CH2PO(0C2HS)2 H tertButyl CH2CNI(C2HS)2 H tertButyl SHENZYl H tertButyl S-Thienyl-methyl H tertButyl Z-Thienyl-methyl H tertButyl Z-Thienyl-methyl H tertButyl Z-Frenayl-methyl H tertButyl Z-Frenayl-methyl H tertButyl Z-Frenayl-methyl H tertButyl Z-Frenayl-methyl H tertButyl Z-Frenayl H tertButyl Z-Phenyl H tertButyl Z-NO2-4-F-Phenyl	ecnyı	: =	tertButyl		CH ₂ CCl ₃		0	0
H tertButy] CH2PO(0C2H5)2 H tertButy] CH2PO(0C2H5)2 H tertButy] CH2PO(0C2H5)2 H tertButy] CH2-CON(C2H5)2 H tertButy] LertButy]	so-rropy!	: =	tertButyl		CH ₂ CH ₂ Si (CH ₃) ₃		0	0
H tert.—Butyl CH2PO(0C2H5)2 H tert.—Butyl CH(CH3)CH(0CH3)2 H tert.—Butyl CH2-CON(C2H5)2 H tert.—Butyl Benzyl H tert.—Butyl 2,4-(C1,C1)-Benzyl H tert.—Butyl 2-Thienyl-methyl H tert.—Butyl 2-Furanyl-methyl H tert.—Butyl 2-Furanyl-methyl H tert.—Butyl 2-Furanyl-methyl H tert.—Butyl 2-Furanyl-methyl H tert.—Butyl 2-Fyridyl-methyl H tert.—Butyl 2-Pyridyl-methyl H tert.—Butyl 2-Pyridyl-methyl H tert.—Butyl 2-Pyridyl-methyl H tert.—Butyl 2-Pyridyl-methyl H tert.—Butyl 2-Phenyl H tert.—Butyl 4-F-Phenyl H tert.—Butyl 3,5-(CF3,CF3)-Phenyl H tert.—Butyl 3,5-(CF3,CF3)-Phenyl	so_propy]	: =	tertButyl		CH2CH20-N=C(CH3)2		0	0
H tertButyl CH(CH3)CH(OCH3)2 H tertButyl CH2-CON(C2H5)2 H tertButyl Benzyl H tertButyl 2,4-(CI,CI)-Benzyl H tertButyl 2-Thienyl-methyl H tertButyl 2-Tetrahydrofuranyl-methyl H tertButyl 2-Pyridyl-methyl H tertButyl C-Pyridyl-methyl H tertButyl 2-Pyridyl-methyl H tertButyl 2-No2-4-F-Phenyl H tertButyl 3,5-(CF3,CF3)-Phenyl H tertButyl 3,5-(CF3,CF3)-Phenyl H tertButyl 4-Trifluormethylphenyl H tertButyl 4-Trifluormethylphenyl H tertButyl 4-Trifluormethylphenyl H tertButyl 4-Trifluormethylphenyl H tertButyl 3,5-(CF3,CF3)-Phenyl	iso-propy	: =	tertButyl		CH2PO(0C2H5)2		0	0
H tertButyl CH ₂ -CON(C ₂ H ₅) ₂ H tertButyl Benzyl H tertButyl 2,4-(Cl,Cl)-Benzyl H tertButyl 2-Thienyl-methyl H tertButyl 2-Furanyl-methyl H tertButyl 2-Furanyl-methyl H tertButyl 2-Pyridyl-methyl H tertButyl 4-F-Phenyl H tertButyl 4-F-Phenyl H tertButyl 4-Trifluormethylphenyl H tertButyl 3,5-(CF ₃ ,CF ₃)-Phenyl H tertButyl 4-Trifluormethylphenyl H tertButyl 4-OCH ₃ -Phenyl H tertButyl 3,5-(CF ₃ ,CF ₃)-Phenyl	iso-propy]	.	tertButyl		сн(сн3)сн(осн3)2		0	0
H tertButyl 2,4-(Cl,Cl)-Benzyl 0 H tertButyl 2,4-(Cl,Cl)-Benzyl 0 H tertButyl 2-Thienyl-methyl 0 H tertButyl 2-Furanyl-methyl 0 H tertButyl 2-Furanyl-methyl 0 H tertButyl 2-Pyridyl-methyl 0 H tertButyl 4-F-Phenyl 0 H tertButyl 4-F-Phenyl 0 H tertButyl 3,5-(CF3,CF3)-Phenyl 0 H tertButyl 4-OCH3-Phenyl 0 H tertButyl 4-OCH3-Phenyl 0 H tertButyl 6-OCH3-Phenyl 0 H tertButyl 0	so-propy!	I	tertButyl		CH2-CON(C2H5)2		0	0
H tertButy 2,4-(C1,C1)-Benzyl 0 H tertButy 3-Pyridyl-methyl 0 H tertButyl 2-Thienyl-methyl 0 H tertButyl 2-Furanyl-methyl 0 H tertButyl 2-Furanyl-methyl 0 H tertButyl	so-propy]	I	tertButyl		Benzyl		0	0
H tertButyl 3-Pyridyl-methyl 0 H tertButyl 2-Thienyl-methyl 0 H tertButyl 2-Furanyl-methyl 0 H tertButyl 2-Pyridyl-methyl 0 H tertButyl 4-F-Phenyl 0 H tertButyl 4-F-Phenyl 0 H tertButyl 3,5-(CF 3, CF 3)-Phenyl 0 H tertButyl 3,5-(CF 3, CF 3)-Phenyl 0 H tertButyl 4-OCH3-Phenyl 0 H tertButyl 3,5-(CF 3, CF 3)-Phenyl 0	ryclo-Probyl	Ŧ	tertButyl		2, 4-(Cl, Cl)-Benzyl		0	0
H tertButyl 2-Thienyl-methyl 0 1 tertButyl 2-Furahydrofuranyl-methyl 0 2 Furahydrofuranyl-methyl 0 2 Furahydrofuranyl-methyl 0 4 tertButyl 4-F-Phenyl 0 4 tertButyl 4-F-Phenyl 0 4 tertButyl 2-NO ₂ -4-F-Phenyl 0 4 tertButyl 3,5-(CF ₃ ,CF ₃)-Phenyl 0 4 tertButyl 3,5-(CF ₃ ,CF ₃)-Phenyl 0	cyclo-Propy]	Ŧ	tertButyl		3-Pyridyl-methyl		0	0
H tertButyl 2-Tetrahydrofuranyl-methyl 0 H tertButyl 2-Furanyl-methyl 0 H tertButyl 4-F-Phenyl 0 H tertButyl 4-F-Phenyl 0 H tertButyl 2-NO ₂ -4-F-Phenyl 0 H tertButyl 3,5-(CF ₃ ,CF ₃)-Phenyl 0 H tertButyl 3,5-(CF ₃ ,CF ₃)-Phenyl 0	cyclo-ropy:	Ξ	tertButyl		2-Thienyl-methyl		0	0
H tertButyl 2-Furanyl-methyl 0 H tertButyl 2-Pyridyl-methyl 0 H tertButyl 4-F-Phenyl 0 H tertButyl 2-NO ₂ -4-F-Phenyl 0 H tertButyl 3,5-(CF ₃ ,CF ₃)-Phenyl 0 H tertButyl 3,5-(CF ₃ ,CF ₃)-Phenyl 0	cyclo ricky:	=	tertButyl		2-Tetrahydrofuranyl-m	ethyl	0	0
H tertButy 2-pyridyl-methyl	cyclo ricpji	=	tertButyl		2-Furanyl-methyl		0	0
H tertButy 4-F-Pheny 0 4-F-Pheny 0 0 0 0 0 0 0 0 0	cyclo-Pronyl	I	tertButyl		2-Pyridyl-methyl		0	0
H tertButyl 4-F-Phenyl H tertButyl 4-Trifluormethylphenyl OH tertButyl 2-NO ₂ -4-F-Phenyl OH tertButyl 3,5-(CF ₃ ,CF ₃)-Phenyl OH tertButyl 4-OCH ₃ -Phenyl	cyclo frogs.	I	tertButyl		Phenyl		0	0
H tertButyl 4-Trifluormethylphenyl 0 H tertButyl 2-NO ₂ -4-F-Phenyl 0 H tertButyl 3,5-(CF ₃ ,CF ₃)-Phenyl 0 H tertButyl 4-OCH ₃ -Phenyl 0	cjeta 11 cpj.	Ξ	tertButvl		4-F-Phenyl		0	0
H tertButyl 2-NO ₂ -4-F-Phenyl 0 H tertButyl 3,5-(CF ₃ , CF ₃)-Phenyl 0 H tertButyl 4-OCH ₃ -Phenyl 0	A1131	: =	tertButyl		4-Trifluormethylpheny	_	0	0
1 3,5-(CF ₃ ,CF ₃)-Phenyl 0 1 1 tertButyl 4-0CH ₃ -Phenyl 0	A1131	.	tertButyl		2-N0 ₂ -4-F-Pheny l		0	0
H tertButyl 4-OCH ₃ -Phenyl 0	A1131	: =	tertButyl		3, 5-(CF3, CF3)-Phenyl		0	0
	A1151	I	tertButyl		4-0CH ₃ -Phenyl		0	0

Ally	50	45	40	35	30	25	20	15	10		5 ·	
H tertButy]		Œ	£2	₩ 4			R5			×	-	
H tert.—Buty] H tert.—Buty]	11	1	-	tertButvl			4-ocF ₃ -Phen	- X		0	O	
H tertButy]				tertButvl			4-NHCOCH3-P	henyl		0	0	
H tertButy]	1 y 1	. 4		tertButvl			2-Tetrahydr	opyranyl		0	0	
H tert.—Butyl Ithio	niny! Fizz.	• •	: I	tertButyl			2-Tetrahydr	opyranyl		0	0	
H tertButyl	יים ביים ביים ביים ביים ביים ביים ביים	•	: I	tertButyl			1-Benzotria	zolyl		0	0	
H tert.—Butyl	hinyi	•	: ±	tertButyl			Methyl			0	0	
H tertButyl	1		: I	tertButyl			Ethyl			0	0	
H tertButyl	ning.		: =	tertButyl			n-Propyl			0	0	
H tertButyl	niny.	•	· •	tertButyl			iso-Propyl			0	0	
H tert.—Butyl	######################################		: I	tertButyl			n-Butyl			0	0	
H tert.—Butyl Thio	thoxy		.	tertButyl			iso-Butyl			0	0	
H tert.—Butyl	+box v		Ŧ	tertButyl			sekButyl			0	0	
H tertButyl	thox.		=	tertButyl			tertButyl			0	0	
lenoxy H tertButyl	thoxy +boxy		=	tertButyl			cyclo-Hexyl			0	o .	
lenoxy H tertButyl henoxy H tertButyl hertButyl hertButyl hertButyl hertButyl hertButyl	thox!		· -	tertButyl			Cyclopropyl	methy1		0	0	
H tertButyl	+hoxy		. .	tertButyl			Ethoxymethy	-		0	0	
H tertButyl	Clebonovy		· -	tertButyl			2-Methooxy-	ethoxy-meth	ıyı	0	0	
H tertButyl	C1-Flielloxy		· I	tertButyl			Benzyloxyme	thyl		0	0	
H tertButyl H tertButyl H tertButyl H tertButyl H tertButyl	ct-ruenoxy		: =	tertButyl			(4-Brombenz	oyl)-methyl		0	0	
H tertButyl H tertButyl H tertButyl H tertButyl H tertButyl	-CI-Phenoxy		: =	tertButvl			(4-Methoxyb	enzoyl)-met	.hy1	0	0	
H tertButyl H tertButyl H tertButyl H tertButyl	-CI-Frienday		: =	tort -Butul			Phthal imido	omethy l		0	0	
H tertButyl H tertButyl H tertButyl	-Cl-Phenoxy		= =	tont putx1			Methylthion	nethyl		0	0	
H tertButyl H tertButyl	-C1-Phenoxy		= :	tertbutyl			2-Thiomethy	1-ethyl		0	0	
H tertButyl	-C1-Phenoxy		= :	tertbuty:			CH(CeH5)CO	CH ₃		0	0	
H tertButyl	henylthio		I	tertButyl			Obcaulathul	,		C	C	
	henylthio		I	tertButyl			rneny letny	_		>	>	

55	50	45	40	35	30	25	20	15	10	5	-	
							,			2	:	
R.1			R 3	R4			R5			×	_	1
											-	
Dhanvlthio	oi e		I	tertButy	11		4-F-Phenylethyl	thyl		0		
Dhony 1	9 9		· I	tertButy	_		Phthal imido			0	0	
Pheny Linio	0 (: =	tertButv			Tetrahydrop	Tetrahydrophthalimido		0	0	
Pneny Luio	012		: 3	tert -Butv			Maleinimido			0	0	
Pheny I thio	0 :		= =	tont -But	: =		Succinimido	-		0	0	
Pheny I th 10	nio		= =	ter tButy			Pineridino			0	0	
2, 4-(01	Z, 4-(C1, C1)Pneny t		= =	tort and			+			0	0	
2, 4-(CI	, CI)-Pheny I		E 3	tort but			+ E			0	0	
2, 4-(cl	, CI)-Phenyl		Ξ	tertButy	1		2 + 2 2			• •	_	
2, 4- (c1	,C1)-Phenyl		I	tertButy	- A					•	.	
2, 4-(C1	,C1)-Phenyl		I	tertButy	yl		* * * HN			0	o	
2.4-(Cl	.cl)-Phenyl		I	tertButy	yl		Diisopropylammonium	l ammon i um		0	0	
2, 4- (C)	2, 4-(C1, C1)-Phenyl		I	tertButy	yl	•	2-Hydroxye	2-Hydroxyethyl-ammonium		0	0	
2-Thien			I	tertButy	yl		Allyl			0	0	
2-Thien	. (.		I	tertButyl	yl		Methallyl			0	0	
2_Thienyl			Ι	tertButy]	۷.		2-Chlorallyl	/1		0	0	
2-Thieny			I	tertButy	y l		Propargyl			0	0	
2-Thieny	. [^!		I	tertButyl	y1		3-Iodpropargyl	rgyl		0	0	
Chlor			I	cyclo-Propyl	pyl		4-Hydroxy-2-butinyl	2-butinyl		0	0	
Chlor			I	cyclo-Propy	pyl		N=C(C ₂ H ₅) ₂			0	0	
2019			x	cyclo-Propyl	pyl		N=C(cyclo-C3H5)2	C3H5) 2		0	0	
ה ביול היים ביולים			T	cvclo-Propy	py1		2-Butanimino	0L		0	0	
20142			=	cyclo-Propy	lyd		Cyclohexanimino	imino		0	0	
ביים בי			Ξ	cyclo-Propy	l y d		Cyclooctanimino	imino		0	0	
Methyl			Ŧ	cyclo-Propy	pyl		N=CH-C ₆ H ₅			0	0	
Methyl			I	cyclo-Propy	pyl		2-Furyl-methanimino	thanimino		0	0	
•												

50 55	45	40	35	30	25	20	15	10	5	
R1		R3	R4			R5			×	-
Methyl		Ŧ	cyclo-Propyl			CH2CH2N(CH3)2)2		0	0_
Methyl		I	cyclo-Propyl			CH2CH2N+(CH3)31	3) 31-		0	0
Methyl		I	cyclo-Propyl			CH ₂ CF ₃			0	0
Methyl		I	cyclo-Propyl			CH ₂ CH ₂ C1			0	0
Methyl		I	cyclo-Propyl			CH ₂ CH ₂ CN			0	0
iso-Propyl		I	cyclo-Propyl			CH ₂ CC1 ₃			0	0
iso-Propyl		I	cyclo-Propyl			CH ₂ CH ₂ Si (CH ₃) ₃	3)3		0	0
iso-Propyl		I	cyclo-Propyl			CH2CH20-N=C(CH3)2	(CH ₃) ₂		0	0
1so-Propyl		I	cyclo-Propyl			CH2PO(0C2H5)2)2		0	0
iso-Propyl		I	cyclo-Propyl			сн(сн3)сн(осн3)	CH3)2		0	0
1so-Propy1		I	cyclo-Propyl			CH2-CON(C2H5)	5)2		0	0
1so-Propyl		Ξ.	cyclo-Propyl			Benzyl			0	0
cyclo-Propy	_	I	cyclo-Propyl			2, 4-(C1, C1)-Benzyl	-Benzyl		0	0
cyclo-Propy	-	I	cyclo-Propyl			3-Pyridyl-methyl	ethyl		0	0
cyclo-Propy	-	I	cyclo-Propyl			2-Thienyl-methyl	ethyl		0	0
cyclo-Propy	,	I	cyclo-Propyl			2-Tetrahydr	2-Tetrahydrofuranyl-methyl	_	0	0
cyclo-Propy		I	cyclo-Propyl			2-Furanyl-methyl	ethyl		0	0
cyclo-Propyl		I	cyclo-Propyl			2-Pyridyl-methyl	ethyl		0	0
cyclo-Propyl	1	I	cyclo-Propyl			Phenyl			0	0
Allyl		I	cyclo-Propyl			4-F-Phenyl			0	0
Allyl		I	cyclo-Propyl			4-Trifluorm	4-Trifluormethylphenyl		0	0
Allyl		I	cyclo-Propyl			2-NO ₂ -4-F-Pheny1	henyl		0	0
Allyl		I	cyclo-Propyl			3, 5-(CF 3, CF 3)-Phenyl	3)-Phenyl		0	0
Allyl	٠	Ŧ	cyclo-Propyl			4-0CH ₃ -Phenyl	ıyı		0	0
Allyl		I	cyclo-Propyl			4-OCF ₃ -Phenyl	ly1		0	0

50 55	45	40	35	30	25	20	15	10	5	_	
7		a E	70			e S			×	>	
RI										-	
41161		Ξ	cvclo-Probvl			4-NHCOCH ₃ -Phenyl	ıenyl		0	0	
At 1 y 1		: =	cvclo-Probvl			2-Tetrahydropyranyl	pyranyl		0	0	
Ethiny L		: 1	cvclo-Propvl			2-Tetrahydropyranyl	pyranyl		0	0	
Ethinyi		: :	cycle ricky:			1-Renzotriazolvl	20171		0	0	
Ethinyl		E .	cyclo-rropy:			10 th:			C	c	
Ethinyl		I	cyclo-Propyl			Metnyı			•	• •	
Ethinyl		I	cyclo-Propyl			Ethyl)	> (
Fthinvl		I	cyclo-Propyl			n-Propyl			0	0	
Ethinvl		Ξ	cyclo-Propyl			iso-Propyl			0	0	
Mothoxy		I	cyclo-Propyl			n-Butyl			0	0	
Methoxy		.	cvclo-Propyl			iso-Butyl			0	0	
Methoxy		: Ξ	cyclo-Propyl			sekButyl		•	0	0	
Methoxy		: =	cyclo-Propyl			tertButyl			0	0	
Methoxy		.	cyclo-Propyl			cyclo-Hexyl			0	0	
Mothox		: :	cvclo-Propyl			CyclopropyImethyl	methyl		0	0	
Mothox		Ξ	cvclo-Propyl			Ethoxymethyl	-		0	o .	
A-C1-Phonoxy		: I	cyclo-Propyl			2-Methoxy-e	2-Methoxy-ethoxy-methyl		0	0	
/-CI-Filenoxy		: =	cyclo-Propyl			Benzyloxymethyl	thyl		0	0	
V-C1-Dhenoxy		Ξ	cvclo-Propyl			(4-Brombenz	(4-Brombenzoxyl)-methyl		0	0	
ליסויסאלין ניסין		: =	cvclo-Propvl			(4-Methoxyb	(4-Methoxybenzoxyl)-methyl	hy l	0	0	
4-CI-PHEHOXY		: I	cvclo-Propvl			Phthalimidomethy	methyl		0	0	
4-CI-FIIEIIOAY		: :	Lynna-ofour			Methylthiomethyl	ethyl		0	0	
4-C1-Phenoxy		E :	cyclo-riopy i			2_Thiomethul-ethul	1-ethvl		0	0	
4-C1-Phenoxy		I	cyclo-Propyl			2-1010mecmy	r central		• •		
Phenylthio		I	cyclo-Propyl			CH(C6H5)CUUCH3	C#3		•	.	
Phenylthio		I	cyclo-Propyl			Phenyletnyl	•		>	> 0	
Phenylthio		I	cyclo-Propyl			4-F-Phenylethyl	thyi		5	>	

50 55	45		40	35	30 ·	25	20	15	10	5	
R1		R3	4			RS	5			×	_
Pheny I thio		I	cyclo-	cyclo-Propyl		۵	Phthalimido			0	0
Phenylthio		I	cyclo-	cyclo-Propyl		Ē	Tetrahydrophthalimido	hal imi do		0	0
Pheny Ithio		I	cyclo-	cyclo-Propyl		Σ	Maleinimido			0	0
Pheny lthio		I	cyclo-	cyclo-Propyl		Ś	Succinimido			0	0
2, 4-(C1, C1)-Pheny	eny l	I	cyclo	cyclo-Propyl		•	Piperidino			0	0
2, 4-(C1, C1)-Pheny	ienyl	I	cyclo	cyclo-Propyl			ri+			0	0
2, 4-(C1, C1)-Ph	enyl	¥	cyclo	cyclo-Propyl		Z	Na+			0	0
2, 4-(c1, c1)-Phenyl	eny l	x	cyclo	cyclo-Propyl		×	+			0	0
2. 4-(C1, C1)-Ph	eny l	I	cyclo	cyclo-Propyl		Z	NH¢+			0	0
2, 4-(C1, C1)-Pheny	leny l	I	cyclo	cyclo-Propyl		٥	Diisopropylammonium	mon i um		0	0
2.4-(c1,c1)-Pt	lenyl	I	cyclo	cyclo-Propyl		7	2-Hydroxyethyl-ammonium	1-ammonium		0	0
2-Thienyl)	I	cyclo	cyclo-Propyl		*	Allyl			0	0
2-Thienyl		I	cyclo	cyclo-Propyl		Σ	Methallyl			0	0
2-Thienyl		I	cyclo	cyclo-Propyl		7	2-Chlorallyl			0	0
2-Thienyl	-	I	cyclo	cyclo-Propyl		a	Propargyl			0	0
2-Thienyl		I	cyclo	cyclo-Propyl		m	3-Iodpropargyl	_		0	0
, =		I	tert.	tertButyl		'	-N=C (CH3) 2			0	0
: 1		I	tert.	tertButyl		1	-N=C (CH3) 2			0	0
. 13		I	tert.	tertButyl		•	-N=C (CH3) 2			0	0
Methyl		I	tert.	tertButyl		•	-N=C (CH3) 2			0	0
Ethvl		I	tert.	tertButyl		Į	-N=C(CH ₃) ₂			0	·o
n-Probvl		I	tert.	tertButyl		1	-N=C (CH3) 2			0	0
iso-Propyl		I	tert.	tertButyl		·	-N=C (CH3) 2			0	0
n-Buty]		I	tert.	tertButyl		•	-N=C (CH3) 2			0	0
iso-Butyl		I	tert.	tertButyl		,	-N=C (CH3) 2			0	0

50 55	4 5	40	35	30	25	20	15	10	Ü	5
R.1		R 3	R4		4	R5			×	>
										-
sekButyl		I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	-0
tertButyl		I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	0
cyclo-Propyl		I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	0
cyclo-Butyl		I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	0
cyclo-Pentyl		I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	0
cyclo-Hexyl		I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			<u>.</u>	0
cyclo-Heptyl		.	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	0
cyclo-Octyl		I	tertButyl			-N=C(CH3)2			0	0
1-Methylcyclopropyl	opyl	I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	0
Trifluormethy!		I	tertButyl			-N=C(CH3)2			0	0
Chlordifluormethyl	hyl	I	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0
Pentafluorethyl		I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	0
iso-Propoxy		I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	0
Methoxymethyl		I	tertButyl			-N=C (CH ₃) ₂			0	0
1-Methylmethoxymethyl	methyl	I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	0
1-Methylmethoxyethyl	ethyl	I	tertButyl			-N=C(CH3)2			0	0
Ethoxymethyl		Ξ	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	0
Vinyl		I	tertButyl			-N=C (CH ₃) ₂			0	0
Allyl		I	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0
Methallyl		I	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0
Crotyl		I	tertButyl			-N=C (CH ₃) ₂			0	0
Ethinyl		I	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0
Propargyl		I	tertButyl			-N=C (CH ₃) ₂			0	0
Phenylethinyl		I	tertButyl			-N=C (CH ₃) ₂			0	0
Methoxy		Ŧ	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	0

55	50	45	40	35	30	.25	20	15	10	5	_	
1			£3	4			25			×	>	
											_	1
3-SCF 3-	Phenyl		Ŧ	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	-0	
2, 4- (NO	2, 4- (NO ₂ , NO ₂)-Phenyl		I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	0	
4-N02-P	henyl		I	tertButyl			-N=C(CH3)2			0	0	
2-Thienyl	lų		I	tertButyl			-N=C(CH3)2			0	0	
3-Thien	ly1		I	tertButyl			-N=C(CH3)2			0	0	
2-Furanyl	lyl		I	tertButyl			-N=C (CH3) 2			0	0	
3-Furan	lyi		I	tertButyl			-N=C(CH3)2			0	0	
2-Tetra	2-Tetrahydrofuranyl		I	tertButyl			-N=C(CH3)2			0	0	
3-Tetra	3-Tetrahydrofuranyl		I	tertButyl			-N=C(CH3)2			0	0	
· 2-Pyridyl	lyl		I	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0	
3-Pyridyl	lyl		I	tertButyl			-N=C(CH3)2	٠		0	0	
4-Pyridyl	lyl		I	tertButyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0	
2-Tetra	2-Tetrahydropyranyl		r	tertButyl			-N=C(CH3)2			0	0	
3-Tetra	3-Tetrahydropyranyl		I	tertButyl			-N=C(CH3)2			0	0	
4-Tetra	4-Tetrahydropyranyl		· ±	tertButyl			-N=C(CH3)2			0	•	
I			I	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0	
Ŀ			I	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0	
ច			I	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0	
Methyl			I	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0	
Ethyl			I	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0	
n-Propy	71		I	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0	
iso-Propyl	lydo		I	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0	
n-Butyl			I	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0	
iso-Buty	tyl		Ξ	cyclo-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0	
sekButyl	utyl		I	cyclo-Propyl			-N=C (CH ₃) ₂			0	0	

R1	50 55		45	40		35	30	25	20	15	10	5	
hoxy H cyclo-Propyl -N=C(CH3)2 0 hylthio H cyclo-Propyl -N=C(CH3)2 0 hylthio H cyclo-Propyl -N=C(CH3)2 0 -Phenoxy H cyclo-Propyl -N=C(CH3)2 0 -Phenoxy H cyclo-Propyl -N=C(CH3)2 0 xy H cyclo-Propyl -N=C(CH3)2 0 xy H cyclo-Propyl -N=C(CH3)2 0 ho cyclo-Propyl -N=C(CH3)2 0 henyl H cyclo-Propyl -N=C(CH3)2 0 henyl H cyclo-Propyl -N=C(CH3)2 0 henyl H cyclo-Propyl -N=C(CH3)2 0 yl H cyclo-Propyl -N=C(CH3)2 0 yl H cyclo-Propyl -N=C(CH3)2 0 yl H cyclo-Propyl -N=C(CH3)2 0 ch3, CH3, Phenyl H cyclo-Propyl -N=C(CH3)2 0					4				R S			×	۲-
hylthio H cyclo-Propyl -N=C(CH3)2 0 hylthio H cyclo-Propyl -N=C(CH3)2 0 0 hylthio H cyclo-Propyl -N=C(CH3)2 0 0 0 phenoxy H cyclo-Propyl -N=C(CH3)2 0	RI												-
Harry Harr		2		3	Cvc 10-Pr	obvl			-N=C(CH3)2			0	0
hylthio H cyclo-PropylN=C(CH3)	IFITIUOFMETIK	r.		: :	cyclorer	, no			-N=C(CH3)2			0	0
hylthio	Methylthio			E .	יוברות.				" (CHJ) J=N-			0	0
H Cyclo-Propy	Trifluormeth	ylthio		I	cyclo-Pr	opyı			-N-C(CH3)2			· c	
xy	Phenoxy			I	cyclo-Pr	opyl			-N=C(CH3)2				
xy	4-C1-Phenoxy			I	cyclo-Pr	opyl			-N=C(CH3)2			o (5 (
H cyclo-Propyl	2 4-(C1 C1)-1	Phenoxy		×	cyclo-Pr	opyl			-N=C(CH3)2			0	0
H Cyclo-PropylN=C(CH3)2	Crator + 77			=	cyclo-Pr	opyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0
H Cyclo-Propyl	4-Cr3-rileilon	-		: =	cvclo-Pr	l vdo			-N=C(CH3)2			0	0
H cyclo-Propyl	Prieny i	4		: 3	-01 2 2 2	[Ado			-N=C(CH3)2			0	0
H cyclo-Propyl	Z-F-Phenyltn	01		= =	יי סוטנט	. Cab.			-N=C (CH3) 2			0	0
H cyclo-Propyl	3-F-Pneny I	•		: :		ָרְאַרָּטְיּ (אַנְיּטִיּ			-N=C(CH ₃) ₂			0	0
Cyclo-Propy	2, 4-(F,F)-Pn	eny i		= =		· cho			-N=C(CH ₃) ₂			0	0
H	2-C1-Phenyi			= =		1 (40)			-N=C(CH3)2			0	0
Phenyl H cyclo-Propyl - N=C(CH3) 2	3-C1-Phenyl			E :	cyclo-ri	opy.			-N=C (CH3) 3			0	0
H cyclo-Propyl	5, 4-(c1, c1)-	Pheny l		= :	cyc 10-P1	opyı			-N=C (CH3) 2			0	0
H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl H cyclo-Propyl SH3, CH3) - Phenyl H cyclo-Propyl CH3, CH3, - Phenyl H cyclo-Propyl CH3, - Phenyl H cyclo-Propyl CH3, - Phenyl H cyclo-Propyl - N=C(CH3) 2 -	2-CH3-Phenyl			=	cyc10-71	ropy i			7 (5 HZ) 2 H			0	0
H cyclo-Propyl	3-CH ₃ -Pheny l	_		I	cyclo-Pi	ropyl			2 (CH3) 2-W-			· c	· c
Phenyl -N=C(CH3)2 0 Phenyl H cyclo-Propyl -N=C(CH3)2 0	4-CH3-Pheny	_		Ŧ	cyclo-Pi	ropyl			-N=C(CH3)2			· c	· c
Phenyl -N=C(CH3)2 O H cyclo-Propyl -N=C(CH3)2 O H cyclo-Propyl -N=C(CH3)2 O Iyl H cyclo-Propyl O H cyclo-Propyl -N=C(CH3)2 O H cyclo-Propyl -N=C(CH3)2 O H cyclo-Propyl -N=C(CH3)2 O	2, 4- (CH ₃ , CH ₃	3)-Pheny	_	I	cyc 10-Pı	ropyl			-N=C(CH3)2			· c	
H cyclo-Propyl	2, 4, 6- (CH ₃ , C	CH 1, CH 1).	-Pheny l	I	cyclo-P	ropyl			-N=C(CH3)2			> 0	> 0
H cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl H cyclo-Propyl N=C(CH3)2 O N=C(CH3)2 O N=C(CH3)2	2-CF a-Phenv	; ; 		I	cyclo-P	ropyl			-N=C(CH ₃) ₂			o (د د
H Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl Cyclo-Propyl -N=C(CH ₃) ₂ O -N=C(CH ₃) ₂ O	2-OCH 3-Pheny	5		I	cyclo-P	ropyl			-N=C(CH3)2			o ()
H Cyclo-Propyl -N=C(CH ₃) ₂ 0 H Cyclo-Propyl -N=C(CH ₃) ₂ 0 H Cyclo-Propyl -N=C(CH ₃) ₂ 0	2 harry firms Of	rus)-Phe	1	I	cyc 10-P	ropyl			-N=C(CH3)2			0	0
$\begin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	2, 4- (och 3, 0)	/5		=	cyc 10-P	ropyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0
H CVClo-Propyl -N=C(CH ₃) ₂ 0	4-Ocr3-rilen			=	cvc10-P	ropyl			-N=C (CH3) 2			0	0
	4-Sch3-rifeii			: =	cvclo-P	ropyl			-N=C (CH ₃) ₂			0	0

55	50	45	40		35	30	25	20	15	10	5 ·		
			7	ć				Ş			×	>-	
2			2	X									1
2 4-(NO 2.	2.4-(NO., NO.)-Phenyl		I	cyclo-Propyl	opyl			-N=C(CH3)2			0	ō	
6-NO-Pheny	1 × 1		I	cyclo-Propyl	opyl			-N=C (CH3) ₂			0	0	
2-Thienvl			I	cyclo-Propyl	opyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0	
3-Thienvi			Ξ	cyclo-Propy	opyl			-N=C(CH3)2			0	0	
2-Furany			×	cyclo-Propy	opyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0	
3-Furanyl			Ŧ	cyclo-Propy	opyl			-N=C(CH3)2			0	0	
2-Tetrahy	2-Tetrahvdropfuranyl		I	cyclo-Propy	opy1			-N=C(CH ₃) ₂			0	0	
3-Tetrahy	3-Tetrahydrofuranyl		I	cyclo-Propy	opyl			-N=C (CH3) 2			0	0	
2-Pyridyl			I	cyclo-Propy	opyl			-N=C(CH3)2			0	0	
3-Pvridyl			I	cyclo-Propy	opyl			-N=C (CH3) 2			0	0	
4-Pvridvl			I	cyclo-Propy	opy l			-N=C (CH3) 2			0	0	
2-Tetrahy	2-Tetrahydropyranyl		I	cyclo-Propyl	opyl			-N=C (CH3) 2			0	0	
3-Tetrahy	3-Tetrahydropyranyl		I	cyclo-Propy	opy l			-N=C (CH3) 2			0	0	
6-Tetrahy	4-Tetrahydropyranyl		I	cyclo-Propy	opy1			-N=C (CH ₃) ₂			0	0	
(m) or			Ξ	Methyl				I			0	0	
20192			I	Ethyl				ı.			0	0	
Chlor			Ŧ	n-Propyl				I			0	0	
Chlor			I	iso-Propy	ny l			I			0	0	
io do			I	n-Butyl				I			0	0	
Chlor			I	iso-Butyl	7			×			0	0	
Methyl			Ξ	sekButyl	tyl			I			0	0	
Mothy!			I	n-Pentyl	·			I			0	0	
Mothy!			I	2-Pentyl	_			I			0	0	
Methy!			I	3-Penty				I			0	0	
Methyl			I	n-Hexyl				I			0	0	
1													

50 55	45	40		35	30	25	20	15	10	•	5
R1	•	R3	R4				R5			*	>
		:					=			•	-
Methoxy		Ī	Z, 4- (CH3	Z, 4- (CH3, CH3)-Pneny I	enyı		=			•	•
Methoxy		x	2, 3, 5-(0	Н3, СН3, С	2, 3, 5-(CH ₃ , CH ₃ , CH ₃)-Phenyl		I			>	o
Methoxy		I	3-CF ₃ -Pheny	eny1			=			0	0
Methoxv		Ξ	3-F-Phenyl	lyl			I			0	0
Methoxy		Ŧ	2-Cl-Phenyl	nyl			I			0	0
Methoxy		I	4-Cl-Phenyl	iny 1			Ŧ			0	0
4-C1-Phenoxy		I	2, 4-(F, F	2, 4-(F, F)-Phenyl			Ŧ			0	0
4-C1-Phenoxy		I	2, 3, 5-(0	2, 3, 5-(c1, c1, c1)-Phenyl	-Pheny 1		×			0	0
4-C1-Phenoxy		I	2-CN-Phenyl	ınyı			*			0	0
4-C1-Phenoxy		I	2-OCH ₃ -Phenyl	henyl			=			0	0
4-Cl-Phenoxy		I	2, 3- (OCH	2, 3- (OCH3, OCH3) -Pheny1	Phenyl		=			0	0
4-C1-Phenoxy	-	I	3, 4, 5-(0	осн ₃ , осн ₂	3, 4, 5- (OCH ₃ , OCH ₃ , OCH ₃)-Pheny	ıy l	Ŧ			0	0
Phenylthio		Ξ	3-OCF ₃ -Phenyl	henyl			I			0	0
Phenylthio		Ξ.	4-0CF 2CH	4-OCF ₂ CHF ₂ -Phenyl	-		Ŧ			0	0
Phenylthio		Ξ	2-SCH ₃ -Pheny l	henyl			Ŧ			0	0
Phenylthio		I	2, 4- (SCF	2, 4- (SCH3, SCH3)-Pheny	-Pheny1		Ŧ			0	0
Phenylthio		I	2-SCF ₃ -Phenyl	henyl			I			0	0
Phenylthio		I	4-NO ₂ -Phenyl	nenyl			I			0	0
2 4-(Cl. Cl)-Phenyl	Pheny 1	Ξ	2, 4- (NO	2, 4- (NO ₂ , NO ₂)-Phenyl	nenyl		=			0	0
2, 4-(C1, C1)-	-Phenyl	I	2-CHO-Pheny	henyl			I			0	0
2, 4-(C1, C1)-Phenyl	-Phenyl	Ŧ	3-COCH ₃ -Phenyl	-Phenyl			Ŧ			0	0
2 4-(C1,C1)-	-Phenyl	Ξ	3-COCF ₃ -Pheny	-Phenyl			Ŧ			0	0
2 4-(C1, C1)-	-Phenyl	I	1-Naphthy	hy l			Ŧ			0	0
2, 4-(C1, C1)-Pheny ¹	-Pheny l	I	2-Naphthyl	hyl			I			0	0
2-Thienyl	•	I	Piperidimo	imo			I			0	0

55	50	45	40	35	30	25	20	15	10		5	
R1			R3	R4			R5			×	>	1
											-	
2-Thienyl			е =	3-Tetrahydrofuranyl	nyl	_	.			0	0	
2-Thienyl			7 H	4-Tetrahydrofurany	ny 1	_	=			0	0	
2-Thienyl			Н 2	2-Thiazolyl		_	I			0	0	
2-Thienyl			Ŧ	5-CH ₃ -2-Thiazolyl	_	_	Ŧ			0	0	
2-Thienyl			7 H	4-CH3-5-C00H-2-Thiazolyl	hiazolyl	_	I			0	0	
3-Pyridyl			-	Methyl			I			0	0	
3-Pyridyl			T	Ethyl			±			0	0	
3-Pyridyl			=	n-Propyl			=			0	0	
3-Pyridyl			- -	iso-Propyl			I			0	0	
3-Pyridyl			I	n-Butyl			r			0	0	
3-Pyridyl			=	iso-Butyl			ı			0	0	
1so-Propyl		Meti	ıy i	sekButyl			I			0	0	
iso-Propy!		Æ	Methyl r	n-Pentyl			I			0	0	
iso-Propyl		Z	Methyl 2	2-Pentyl			I			0	0	
iso-Pentyl		¥		3-Pentyl			I			0	0	
iso-Propyl		ž		n-Hexyl			I			0	0	
iso-Propyl		Ĭ		2-Hexyl			I			0	0	
iso-Propyl		Ĭ	Methy1	3-Hexyl			I			0	0	
Chlor			=	Methyl			-N=C(CH3)2			0	0	
Chlor				Ethyl			-N=C (CH3) 2			0	0	
Chlor			Ξ	n-Propy1			-N=C(CH3)2			0	0	
Chlor			I	iso-Propyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0	
Chlor			_ _	n-Butyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0	
Chlor			±	iso-Butyl			-N=C(CH ₃) ₂			0	0	
Methyl			=	sekButyl			-N=C(CH3)2			0	0	

55	50	- 4 5	40		3 5	30	25		20	15	10		5	
7			£	4				R5				*	-	
ż												ć	7	
Methyl			I	n-Pentyl) 	-N=C(CH3)2			•	•	
Mothy 1			I	2-Pentyl				∑ =C	-N=C(CH3)2			>	>	
macing i			Ξ	3-Pentvl)=N-	-N=C (CH3) 2			0	0	
Metnyl			: =	n-Hexv1					-N=C(CH ₃) ₂			0	0	
Methy !			: 3)_Hevy]				-N=C	-N=C (CH3) 2			0	0	
Methyi			= =	3-U0vv]				-N=	-N=C(CH ₃) 2			0	0	
iso-Propy	=		. . .	2. Mothul	2-Mothul-2-nentul	•)= <u>¥</u>	-N=C (CH1) 2			0	0	
iso-Propy	.		- E :	Z-MCCIII)	-z-peneg.	_) <u>"</u>	-N=C (CH3) 2			0	0	
1so-Propy	5		E :	cyclo-r	cyclo-riopy imecily i	_		2	-N=C (CH ₃) 2			0	0	
iso-Propy	١,		= :	cyclo-bucy	ורא ו מישינו			: 2	-N=C (CH ₂) 2			0	0	
iso-Propy	y		x :	cyclo-rency i	1 (1) 1)	-N=C(CH ₃) 2			0	0	
iso-Propy	lk		E :	cyclo-nexyl	Ay 1	-)= -	-N=C (CH ₂) 2			0	0	
cyclo-Propy	opyl		= :	I-Mecny	I-Metnylcyclonexyl	11		: Z	-N=C(CH3)3			0	0	
cyclo-Propy	opyl		= :	3-Trifli	ormetny ic	3-Trifluormethylcyclonexyl			-N-C(CH3)2 -N=C(CH3)3			0	0	
cyclo-Propy	opyl		x :	Allyl	:			: Z	-N=C (CH3) 2			0	. 0	
cyclo-Propy	opyl		=	I-Buten-3-yı	-3-yı			: Z	-N=C (CH2) 3			0	0	
cyclo-Propy	l kdo.		I	Crotyl				2 2	-N=C(CH3)2			0	0	
cyclo-Propyl	opyl.		I :	Propargyl				Z	-N=C(CH3)2 -N=C(CH3)3			0	0	
Allyl			= :	I-Butin-3-yi	-Butin-3-y 40:46	3-11		: 2	-N=C (CH ₃) 2			0	0	
Allyl			E :	3-Merny	ון זיין ביון	•		: 2	-N=C (CH ₃) 2			0	0	
Allyl			I	2-Pentin-4-y	1 6 - h - U			: 2	7 (FHD) J-N			C	0	
Allyl			I	Benzyl					. (cn3) 2			· c	•	
Allvl			I	2-Phenylethyl	lethyl			<u>=</u>	-N=C(CH3)2)	o (
			I	2-Methy	2-Methylthioethyl			*	-N=C (CH3) 2			0	0	
ALLY			=	2-Chlorethyl	ethyl			=	-N=C(CH3)2			0	0	
Ethinyl			: =	2-Metho	2-Methoxyethyl			<u>"</u>	-N=C(CH3)2			0	0	
·														

i.							
	83	R4		R5		×	-
				, (cn2) 2-N		c	-0
Ethinyl	I	2-(N, N-Dimetny lamino) -etny i	minoj-ecnyi	7 (5113) 5		· c	· c
Ethinyl	I	Pheny l		-W=C(cu3) 2		• •	• •
Ethinyl	I	2-CH ₃ -Phenyl		-N=C(CH3)2		-	-
	I	4-CH ₃ -Phenyl		-N=C (CH3) 2		0	0
Eculiny.	: .	2. 4- (CH 2, CH 3) -Phenyl	lenyl	-N=C (CH ₃) ₂		0	0
metnoxy	: I	2, 3, 5- (CH ₃ , CH ₃ , CH ₃) -Phenyl	CH1)-Phenyl	-N=C (CH3) 2		0	0
methoxy	: 1	3-CF 3-Phenyl	•	-N=C (CH ₃) ₂		0	0
Methoxy	: 3	3-F-Phenyl		-N=C (CH ₃) ₂		0	0
Methoxy	: 3	2-Cl-Phenyl		-N=C(CH ₃) ₂		0	0
Methoxy	: 3	A-C1-Phenyl		-N=C(CH ₃) ₂		0	0
Methoxy	= 3	2 4-(F F)-Phenv]		-N=C(CH ₃) ₂		0	0
4-CI-Phenoxy	:	2, 3, 5-(C1, C1, C1)-Phenyl	}-Phenyl	-N=C(CH3)2		0	0
4-CI-FREROAY	: 2	2~CN-Phenyl		-N=C(CH3)2		0	0
4-CI-Fnenoxy	: 3	2-OCH 1-Phenyl		-N=C(CH3)2		0	0
4-C1-Phenoxy	: 3	2 3=(OCH, OCH,)-Phenvl	Phenv]	-N=C(CH3)2		0	0
4-CI-Phenoxy		2, 3 (55113) 5513, 1113,	2. OCH 2) -Phenyl	-N=C(CH ₃) ₂		0	0
4-CI-Phenoxy	: 3	3-0CE 1-Pheny 1		-N=C(CH ₃) ₂		0	0
pheny thio	: :	LOCE CHE Dhanul	[1	-N=C (CH 1) 2		0	0
Phenylthio	E :	3 ccu - bhomy	•	-N=C(CH3)		0	0
Phenylthio	E :	2-scrig-rineing i	Obenvi	-N=C(CH ₂),		0	0
Phenylthio	E	z, 4-(3cn3, 3cn3)-r.icii)	- Lucii j	2 (CHJ) J-W-		c	c
Phenylthio	I	2-SCF ₃ -Phenyl		-N-c(cn3)2		· c	, ,
Phenylthio	I	4-NO ₂ -Phenyl		-N=C(cH3)2		•	•
2 /- (C1 C1) -Phenyl	I	2, 4-(NO ₂ , NO ₂)-Phenyl	henyl	-N=C(CH ₃) ₂		>	>
2,4-(c1,c1) Henyl	.	2-CHO-Phenyl		-N=C(CH ₃) ₂		0	0
2,4-(c1,c1)-ruenyi	: =	3-COCH 1-Phenyl		-N=C(CH ₃) ₂		0	0

5	> ×	0	0			0	0	0	0	0	0 0	0 0	0 0	0	0 0	0 0	0.	0	0 0	0	0 0	0	0	0 0	s 0	s 0	0	
10																												
15																									-Phenyl	•		
20	R5	1000	-N=C(CH3)2	-N=C(CH3)2	-N=C(CH3)2	-N=C(CH ₃) ₂	-N=C(CH1)2	-N=C(CH3) 2	-N=C(CH ₂) 2	N=C(CH3)2-N	2 (SUD) 2-N-	-N=C(CH3)2	-N=C(CH3)3	-N=C(CH3)2	-N=C(CH3)2	-N=C(CH ₃) 2	-N=C(CH ₂) 2	-N=C(CH ₂) 2	-N=C(CH ₃)2	-N=C(CH ₃) ₂	-N=C(CH ₃) ₂	-N=C (CH3) 2	-N=C (CH3) 2	-N=C(CH ₃) ₂	2.4-(Cl, Cl)-Phenyl	2-Pyridyl	Ethyl	
25																												
30			-				[macus]	rur any t	pyranyı	•	zolyl	4-CH ₃ -5-C00H-2-Inlazolyl																
35			3-cocF ₃ -Phenyl	1-Naphthyl	2-Naphthyl		Piperiaino 6 Getrolida	3-letranyaroturany (4-Tetranyaropyranyı	2-Thiazolyi	5-CH ₃ -2-Thiazoly I	-сн ₃ -5-соон	Methyl	Ethyl	n-Propyl	iso-Propy I	n-Butyl	iso-Butyl	sekButyl	n-Pentyl	Z-Pentyl	3-Penty I	n-Hexy I	2-Hexyl	3-Hexyl	tertButyl	tertBulyl tertButyl	
40	R3 R4		H 3-(T =	H 2-		- Z	-	- †	н 2-	H 2-	- †	Ŧ	Ŧ	Ė	Ŧ	_								Methyl 3		= =	
45	•																		_	_								
50			2 4-(C1, C1)-Phenyl	c1)-Phenv1	Z, 4-(C1, C1) -1-2.	, CI)-Pueny	ıyı	ıyı	ıyı	ıyı	ıyı	ny1	dyl	dyl	dyl	dyl	dyl	dyl	l yqoʻ	-opy1	-opy1	ropyl	ropyl	ropyl	ropyl		,	-
55	7		13/-7 6	(0) 7	12) -+ '7	2, 4-(CI	2-Thier	2-Thier	2-Thier	2-Thier	2-Thienyl	2-Thieny	3-Pyridy	3-Pyridy	3-Pyri	3-Pyridy1	3-Pyridy	3-Pyridy	iso-Propy	iso-Propy	iso-Propy	iso-Propy	so-Propy	iso-Propy	iso-Propy	Methyl	Methyl	Methyl

	-																														
	-	-	S	S	S	S	U	, ,	n (es ·	S	S	S	S	v	· ·	י נ	n	S	တ	S	S	S		n	S	S	S	S	S	1
5	×		0	0	0	c	• •	•	> (0	0	0	0	0	C	• •	> (>	0	0	0	0	0	•	>	0	0	0	0	0	ı
10																															
15									٧.)-Phenyl						•				ly l)-Phenyl	•									
20	RS		iso-Propyl	Butyl	tertButvl	Obenia.	Fileny 1	4-F-Pheny I	3-CF 3-Phenyl	2, 4-(C1, C1)-Phenyl	2-Pyridyl	Methyl	Fthvl	iso-Pronvl	table to pay	Buryı	tertButyl	Phenyl	4-F-Pheny l	3-CF ₃ -Phenyl	2. 4-(C1, C1)-Phenyl	2-Pvridvl	Mothy!	He cliss t	Ethyl	iso-Propyl	Butvl	tertButvl	Obonyl	Mothul	שפרווא ו
25																															
30																															
35			hert -Ruty]	tort Dutyl	er cbucy t	tertbuty!	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButvl		tertbutyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tortButvl	tort -Butyl	(c) to 0003 (tertbutyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tort - Butvl		rertbuty!	tertButyi	tertButyl	tertButyl
40	R 4		±		.	H	H Ç	H	Ξ Ç	I				=	I	Ŧ	T T	I	: 3	= =	= :		±	I	I	_			I	=	I
45																															
50								l vac	[^0(. (40	in y	oby i	opyl	opyl	opyl	Propyl	Propv1	v Lucial v		Propyi	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl								х
55	7	- K		Metnyi	Methyl	Methyl	Methyl	1so-Probv	iso-Pronv		1so-ri opy	1so-Propy	iso-Propy	iso-Propy	1so-propy	cyclo-Propy	rvclo-Propy		-01262	cyc10-	cyclo-	cyclo-	cyclo-	A11v1		Allyl	Allyl	Allyl	Allyl	Allyl	Methoxy

5 10	> x	9		n (s 0	s 0	σ	s 0	s 0	henyl 0 S	8 0	s 0	s O	s 0	s o	o	s 0	s 0	s 0	Phenyl 0 S	s 0	s o	s 0	S O	s o	· ·		<i>n</i>
20	RS	,		1so-Propy (Butyl	tertButyl	Phenyl	4-F-Phenyl	3-CF ₃ -Phenyl	2, 4-(c1, c1)-Phenyl	2-Pyridyl	Methyl	Ethyl	iso-Propyl	Butyl	tertButyl	Phenyl	4-F-Phenyl	3-CF ₃ -Phenyl	2, 4-(C1, C1)-Phenyl	2-Pyridyl	Ethy1	iso-Propyl	Butyl	tertButvl	Obenil	rneny i	4-F-Pheny I
25																						•						
30																												
35	R4		tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButvl	tert -Butvl	industrial states	rertbuty1	tertButyl	tertButyl
40	R3		I	I	I	I	I	I	=	I	Ξ	I	I	I	I	÷	=	=	=	I	æ	I	1	: 3	: :	E .	I	±
45																=	: =	: =			. 5	. 5						
50	R1		Methoxy	Methoxy	Methoxy	Methoxy	Methoxy	Methoxy	4-C1-Phenoxy	4-C1-Phenoxy	framour 15 t	4-C1-Phenoxy	toucht - to-y	vxonent 15 +	4-C1-Phenoxy	2 4-(C1 C1)-Phenv	2,4-(C1,C1) Theny	2,4-(C1,C1) Theny	2,4-(C1,C1)-Phenv	2,4-(C1,C1)-Phenyl	2,4 (C1,C1)-Phenv	2 /- (C1 C1)-Phenv	2, 4- (51, 51, 1,151,	renember 2	7-Inlenyi	2-Thienyl	3-Pyridyl	3-Pyridyl

	50	45	40	35 .	30	25	20 8	15	10	×	5	
RI			R3	R4			22			•	-	
			1	tertButvl			3-CF3-Phenyl	ľ		0	· v	
3-Pyriuyi Mothul			: =	cvclo-Propvl			2, 4-(c1, c1)-Phenyl	-Phenyl		0	S	
Metny			: I	cyclo-Propyl			2-Pyridyl			0	S	
Metnyl			: =	cvclo-Propvl			Ethyl			0	S	
Metny (: =	cvclo-Propyl			iso-Propyl			0	S	
Methy!			: I	cvclo-Propyl			Butyl			0	S	
Methy!			: =	cyclo-Propyl			tertButyl	_		0	S	
Mothy!			=	cvclo-Propyl			Pheny 1			0	S	
merny i			; . I	cvclo-Propvl			4-F-Phenyl			0	S	
150-Propy 1			: 3	cvclo-Propvl			3-CF ₃ -Phenyl	yı		0	တ	
1SO-Propy 1			: =	cvclo-Propvl			2, 4-(C1, C1)-Phenyl)-Phenyl		0	S	
iso-Propyl			. .	cyclo-Propyl			2-Pyridyl			0	S	
iso-brony			I	cyclo-Propyl			Methyl			0	S	
iso-Propy			I	cyclo-Propyl			Ethyl			0	S	
ico-brond			I	cyclo-Propyl			iso-Propyl			0	σ.	
130-riopji	_		=	cyclo-Propyl			Butyl			0	S	
cyclo-rropy			Ξ	cyclo-Propyl			tertButyl	1		0	S	
cyclo-Flopy i			=	cyclo-Propyl			Phenyl			0	ဟ	
cyclo-riop			=	cvclo-Propyl			4-F-Phenyl			0	S	
cyc to-Propy	.		: =	cvclo-Propyl			3-CF ₃ -Phenyl	yl		0	S	
cyc 10-Propy	. '		: 3	[wood-ofour			2,4~(Cl,Cl)-Phenyl)-Phenyl		0	S	
cyclo-Propy	<u>_</u>		E :	cyclo-riopy:			2-Pvridvl	•	•	0	S	
cyclo-Propyl	yl		I	cyc to-Propy t			z 13:123: Mothul			C	ď	
Allyl			Ξ.	cyclo-Propyl			Metny 1			•	ט נ	
Allyl			I	cyclo-Propyl			Ethy!			•	י נ	
Allyl			I	cyclo-Propyl			iso-Propyl	•		>	n	

50 55	45	40	35	30	25	20	15	10		5	
		í	7			55 C			×	>	
81		2	K								
		3	- Proposition		٠	Butyl			0	_ _	
Allyl		E :	cyclo fropy:			tertButvl			0	S	
Allyl		= :	cyclo-riopy i			Ohenvl			0	S	
Allyl		I	cyclo-Propy!						c	U	
Methoxy		I	cyclo-Propyl			Methyl			•	, ,	
Methoxy		I	cyclo-Propyl			Ethyl			0	·Λ (
Rothoxy		Ξ	cyclo-Propyl			iso-Propyl			0	'n	
Heriony		: 3	cyclo-Propyl			Butyl			0	S	
Methoxy		: 3	cyclo-propyl			tertButyl			0	S	
Methoxy		E :	cyclo-riopy:			Phenyl			0	S	
Methoxy		<u>F</u>	cyclo-riopyl			/ nedp-y-			0	S	
Methoxy		I	cyclo-Propyl			4-r-rileny			•	v	
Vxoned-(3-7		I	cyclo-Propyl			3-CF 3-Pneny i			> (, (
vxoned-10-7		x	cyclo-Propyl			2, 4-(Cl, Cl)-Phenyl	henyl		0	'n	
t of phonoxy		Ŧ	cvclo-Propyl			2-Pyridyl			0	ဟ	
4-C1-FileHoAy		: 1	cvclo-Probvl			Methyl			0	S	
4-CI-Phenoxy		: :	cyclo-propyl			Ethyl			0	S	
4-C1-Phenoxy		E :	cyclo-riopy i			iso-Probyl			0	S	
4-C1-Phenoxy		I	cyclo-rropy 1			Butul			0	S	
4-C1-Phenoxy		I	cyclo-Propyl			bucy!			· c	ď	
2. 4-(C1, C1)-Phenyl		Ŧ	cyclo-Propyl			tertbuly!			•	٠ (
2 4-(r) c1)-Phenvl		I	cyclo-Propyl			Pheny l			o (n (
2,4 (C1,C1) -pheny]		I	cyclo-Propyl			4-F-Phenyl			0	'n	
Z, 4- (CI, CI) - 1.1CII		: 3	rvrlo-Pronvl			3-CF ₃ -Pheny l			0	S	
2, 4-(C1, C1)-Pneny	-	= :	cyclo from:			2.4-(Cl.Cl)-Phenyl	Phenyl		0	S	
2, 4-(c1, c1)-Phenyl	_	I	cyclo-Propy i			2-Dvridul	•		0	S	
2, 4-(C1, C1)-Pheny ¹		I	cyclo-Propyl			2-r yr 1 u y 1				, v	
2, 4-(C1, C1)-Pheny	_	I	cyclo-Propyl			etnyl			•	, v	
2-Thienyl		=	cyclo-Propyl			1so-Propy i			>	י	

_	
	>
·	× 00000
10	*
15	
	3utyl enyl Phenyl
20	Butyl tertButyl Phenyl 4-F-Phenyl 3-CF ₃ -Phenyl
25	
-	
30	
•	
35	cyclo-Propyl cyclo-Propyl cyclo-Propyl cyclo-Propyl cyclo-Propyl cyclo-Propyl
	cyclo-cyclo-cyclo-cyclo-cyclo-cyclo-cyclo-cyclo-
40	E
45	
50	1 yn 1 l
65	R1 2-Thienyl 2-Thienyl 3-Pyridyl 3-Pyridyl
55	

Die Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide la und lb bzw. die sie enthaltenden herbiziden Mittel können beispielsweise in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen, auch hochprozentigen wäßrigen, öligen oder sonstigen Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln oder Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungformen richten sich nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

Die Verbindungen la und lb eignen sich allgemein zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen. Als inerte Zusatzstoffe kommen Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraftierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraftierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraftierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraftierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraftierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraftierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraftierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraftierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraftierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraftierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraftierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraftierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraftierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraftierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraftierischen Ursprungs, aliphatische und aromatische Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Ursprungs, aliphatische und aromatis

Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Dispersionen, Pasten, netzbaren Pulvern oder wasserdispergierbaren Granulaten durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substrate als solche oder in einem Öl oder von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substrate als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Es können aber auch aus wirksamer Substanz, Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

Als oberflächenaktive Stoffe kommen die Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von aromatischen Sulfonsäuren, z.B. Lignin-, Phenol-, Naphthalin-und Dibutylnaphthalinsulfonsäure, sowie von Fettsäuren, Alkyl- und Alkylarylsulfonaten, Alkyl-, Laurylether- und Fettalkoholsulfaten, sowie Salze sulfatierter Hexa-, Hepta- und Octadecanolen, sowie von Fettalkoholglykolether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Derivate mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäuren mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctyl-, Octyl- oder Nonylphenol, Alkylphenol-, Tributylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether oder Polyoxypropylen, Laurylalkoholpoly glykoletheracetat, Sorbitester, Lignin-Sulfitablaugen oder Methylcellulose in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind Mineralerden wie Silicagel, Kieselsäuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver oder andere feste Trägerstoffe.

Die Formulierungen enthalten zwischen 0,1 und 95 Gew.%, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 Gew.%, Wirkstoff. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90 % bis 100 %, vorzugsweise 95 % bis 100 % (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

45

50

Die erfindungsgemäßen Verbindungen la und lb können beispielsweise wie folgt formuliert werden: I. Man vermischt 90 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 1.003 mit 10 Gewichtsteilen N-Methyl-α-pyrrolidon und erhält eine Lösung, die zur Anwendung in Form kleinster Tropfen geeignet ist.

II. 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 1.010 werden in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen Xylol, 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 5 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 5 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Ausgießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.% des Wirkstoffs enthält.

III. 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 1.004 werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gewichtsteilen Len Cyclohexanon, 30 Gewichtsteilen Isobutanol, 20 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.% des Wirkstoffs enthält.

IV. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 1.011 werden in einer Mischung gelöst, die aus 25 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 65 Gewichtsteilen einer Mineralölfraktion vom Siedepunkt 210 bis 280°C und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch

Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.% des Wirkstoffs enthält.

V. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 1.011 werden mit 3 Gewichtsteilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalin-α-sulfonsäure, 17 Gewichtsteilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gewichtsteilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in 20 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.% des Wirkstoffs enthält.

VI. 3 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 1.003 werden mit 97 Gewichtsteilen feinteiligem Kaolin vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 3 Gew.% des Wirkstoffs enthält.

VII. 30 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 1.004 werden mit einer Mischung aus 92 Gewichtsteilen pulverförmigem Kieselsäuregel und 8 Gewichtsteilen Paraffinöl, das auf die Oberfläche dieses Kieselsäuregels gesprüht wurde, innig vermischt. Man erhält auf diese Weise eine Aufbereitung des Wirkstoffs mit guter Haftfähigkelt.

VIII. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 1.010 werden mit 2 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure, 8 Gewichtsteilen Fettalkohol-polyglykolether, 2 Gewichtsteilen Natriumsalz eines Phenol-Harnstoff-Formaldehyd-Kondensates und 68 Gewichtsteilen eines paraffinischen Mineralöls innig vermischt. Man erhält eine stabile ölige Dispersion.

Die Applikation der herbiziden Mittel bzw. der Wirkstoffe kann im Vorauflauf- oder im Nachauflaufverfahren erfolgen. Sind die Wirkstoffe für gewisse Kulturpflanzen weniger verträglich, so können Ausbringungstechniken angewandt werden, bei welchen die herbiziden Mittel mit Hilfe der Spritzgeräte so gespritzt werden, daß die Blätter der empfindlichen Kulturpflanzen nach Möglichkeit nicht getroffen werden, während die Wirkstoffe auf die Blätter darunter wachsender unerwünschter Pflanzen oder die unbedeckte Bodenfläche gelangen (post-directed, lay-by).

Die Aufwandmengen an Wirkstoff betragen je nach Bekämpfungsziel, Jahreszeit, Zielpflanzen und Wachstumsstadium 0,001 bis 5, vorzugsweise 0,01 bis 2 kg/ha aktive Substanz (a.S.).

In Anbetracht der Vielseitigkeit der Applikationsmethoden können die erfindungsgemäßen Verbindungen bzw. sie enthaltende Mittel in einer großen Zahl von Kulturplfanzen zur Beseitigung unerwünschter Pflanzen eingesetzt werden.

Zur Verbreiterung des Wirkungsspektrums und zur Erzielung synergistischer Effekte können die Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide la und Ib mit zahlreichen Vertretern anderer herbizider oder wachstumsregulierender Wirkstoffgruppen gemischt und gemeinsam ausgebracht werden. Beispielsweise kommen als Mischungspartner Diazine, 4H-3,1-Benzoxazinderivate, Benzothiadiazinone, 2,6-Dinitroaniline, N-Phenylcarbamate, Thiolcarbamate, Halogencarbonsäuren, Triazine, Amide, Harnstoffe, Diphenylether, Triazinone, Uracile, Benzofuranderivate, Cyclohexan-1,3-dionderivate, Chinolincarbonsäurederivate, Aryloxy-, Heteroaryloxyphenoxypropionsäuren sowie deren Salze, Ester und Amide und andere in Betracht.

Außerdem kann es von Nutzen sein, die Verbindungen la und Ib allein oder in Kombination mit anderen Herbiziden auch noch mit weiteren Pflanzenschutzmitteln gemischt gemeinsam auszubringen, beispielsweise mit Mitteln zur Bekämpfung von Schädlingen oder phytopathogenen Pilzen bzw. Bakterien. Von Interesse ist ferner die Mischbarkeit mit Mineralsalzlösungen, welche zur Behebung von Ernährungs-und Spurenelementmängeln eingesetzt werden. Es können auch nichtphytotoxische Öle und Ölkonzentrate zugesetzt werden.

Synthesebeispiele

Die in den nachstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vorschriften wurden unter entsprechender Abwandlung der Ausgangsverbindungen zur Gewinnung weiterer Verbindungen benutzt. Die so erhaltenen Verbindungen sind in den nachstehenden Tabellen mit physikalischen Angaben aufgeführt.

1. Verfahren zur Herstellung der Vorprodukte

Beispiel 1.1

55

45

50

5

10

4(5)-Ethoxycarbonyl-2-methyl-oxazol-5-(4)-carbonsäure

Zu 33,8 g (0,15 mol) 2-Methyl-oxazol-4,5-dicarbonsäureester in 300 ml Ethanol tropfte man bei -10° C unter N₂ innerhalb von 4 h eine Lösung von 6,0 g (0,15 mol) Natriumhydroxid in 150 ml Wasser und rührte 2 h bei -10 °C nach. Man engte die Lösung ein, nahm den Rückstand in 300 ml Wasser auf, stellte mit Salzsäure auf pH = 8 bis 9 ein und extrahierte zweimal mit je 300 ml Diethylether. Anschließend säuerte man mit konz. HCl auf pH = 2 an und extrahierte die wäßrige Phase viermal mit je 250 ml Dichlormethan. Die vereinigten organischen Phasen wurden über Magnesiumsulfat getrocknet und das Solvens im Vakuum abgezogen. Man erhielt 26,4 g (88 %) 4(5)-Ethoxycarbonyl-2-methyl-oxazol-5-(4)-carbonsäure als weißen Feststoff (Isomerenverhältnis: 3:1 (1H-NMR, HPLC). Zu isomerenreiner 4-Ethoxycarbonyl-2-methyl-oxazol-5carbonsäure gelangte man durch fraktionierte Kristallisation aus Cyclohexan/ Ethylacetat 2:1 oder Säulenchromatographie an Kieselgel (Lösungsmittel: Toluol, THF, Eisessig (7:3:1). ¹H-NMR (250 MHz, D₅-DMSO); Hauptisomer: δ = 1,28 (t; 3H), 2,52 (s; 3H), 4,30 (q; 2H), 14,00 (bs; 1H).

Beispiel 1.2

15

4-Ethoxycarbonyl-2-methylthio-thiazol-5-carbonsäure

Eine Lösung von 7,00 g (25 mmol) 2-Methylthio-thiazol-4,5-dicarbonsäurediethylester in 100 ml Ethanol/Wasser (2:1) wurde bei Raumtemperatur innerhalb von einer Stunde mit einer Lösung von 1,10 g (27,5 mmol) Natriumhydroxid in 10 ml Wasser versetzt. Man rührte eine Stunde nach, entfernte dann das Lösungsmittelgemisch im Vakuum, nahm den Rückstand mit 100 ml Wasser auf, extrahierte einmal mit 50 ml Diethylether und säuerte die wäßrige Phase mit konzentrierter Salzsäure an. Das ausgefallene Produkt wurde abgesaugt und getrocknet.

Ausbeute: 4,50 g (73 %). Schmelzpunkt: 104 °C.

Die in der folgenden Tabelle genannten Carbonsäuren wurden gemäß dem vorstehenden Beispiel erhalten:

35	

50

30

Beisp.	R¹	R⁵	X	phys. Daten
1.9(b) 1.4(a)	Phenyl n-Butylthio	CH ₃ C ₂ H ₅	S S	Fp.: 127-137 0,95 (t;3H), 1,40 (t;3H), 1,50(sext;2H), 1,80 (quint;2H), 3,40 (t;2H), 4,35 (q;2H)
1.5(b)	n-Butylthio	C ₂ H ₅	s	0,95 (t;3H), 1,35 (t;3H), 1,50 (sect;2H), 1,80 (quint;2H), 3,30 (t;2H), 4,45 (q;2H)
2.6(b)	iso-Propylthio	C ₂ H ₅	s	1,50 (d;6H), 1,45 (t;3H), 3,90 (hept;1H), 4,55 (q;2H), 12,50 (s;1H)
1.7(a)	iso-Propylthio	C ₂ H ₅	s	1,45 (t;3H), 1,50 (d;6H), 4,05 (hept;1H), 4,50 (q;2H), 12,50 (s;1H)
1.8(a)	Methylthio	CH₃	s	2,80 (s;3H), 4,05 (s;3H)

Beispiel 1.9

2-Methylthiothiazol-4,5-dicarbonsäure-diethylester

Eine Lösung von 9,2 g (0,03 mol) 2-Chlor-thiazol-4,5-dicarbonsäure-diethylester in 30 ml Ethanol wurde bei 0°C tropfenweise mit einer Lösung von 2,1 g (0,03 mol) Natrium-methylthiolat in 10 ml Ethanol versetzt. Man ließ das Gemisch auf 25°C erwärmen und rührte zwei Stunden nach. Danach entfernte man das Lösungsmittel bei vermindertem Druck, nahm den Rückstand in 100 ml Diethylether auf und wusch nacheinander mit je 50 ml 5 %iger Natronlauge und Wasser. Man trocknete über Natriumsulfat, engte ein und behielt 7,2 g (87 %) Produkt als farbloses Öl zurück. ¹H-NMR (CDCl₃, 250 MHz, TMS als interner Standard): 1,35 (t, J=7,0 Hz, 3H), 1,45 (t, J=7,0 Hz; 3H), 2,75

(s, 3H), 4,30 (q, J=7.0 Hz; 2H), 4,50 (q, J=7.0 Hz; 2H).

2. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen Vla und VIb

Beispiel 2.1

5

10

25

30

2-Methoxythiazol-4-carbonsäure-tert.-butylamid

Eine Lösung von 12,00 g (46 mmol) 2-Brom-thiazol-4-carbonsäure-tert.-butylamid in 150 ml Methanol wurde bei 25°C mit 8,90 g einer 30 %igen Lösung (49 mmol) von Natriummethanolat in Methanol versetzt. Man hielt das Gemisch vier Stunden unter Rückfluß auf Siedetemperatur, engte dann die klare Lösung ein, nahm den Rückstand in 300 ml Diethylether auf, filtrierte und entfernte das Lösungsmittel bei vermindertem Druck. Man erhielt 9,60 g (98 %) Produkt als gelbes Öl.

1H-NMR (CDCl₃, 250 MHz, TMS als interner Standard): 1,45 (s; 9H), 4,10 (s; 3H), 7,00 (s, breit, 1H), 7,48 (s; 1H).

Beispiel 2.2

2-Isopropyl-oxazol-4-carbonsäure-cyclopropylamid

Zu einer Lösung von 31,0 g (0,20 mol) 2-isopropyl-oxazol-4-carbonsäure in 200 ml Toluol und 2 ml Dimethylformamid tropfte man bei Raumtemperatur 47,6 g (0,40 mol) Thionylchlorid und rührte 1 h bei 80°C. Man zog die Solventien im Vakuum ab, löste den Rückstand in 300 ml Dichlormethan und tropfte bei 0 bis 10°C 24,0 g (0,42 mol) Cyclopropylamin in 20 ml Dichlormethan zu. Man rührte 12 h bei Raumtemperatur, gab 150 ml Wasser zu, trennte die Phasen, wusch die organische Phase einmal mit gesättigter Natriumhydrogencarbonatlösung, trocknete über Magnesiumsulfat und zog das Solvens im Vakuum ab. Man erhielt 37,2 g (98 %) 2-isopropyl-oxazol-4-carbonsäure-cyclopropylamid. 1 H-NMR (CDCl₃, 250 MHz): Δ = 0,62 (m; 2H), 0,88 (m; 2H), 1,34 (d; 6H), 2,86 (m; 1H), 3,09 (m; 1H), 6,93 (bs; 1H; NH), 8,09 (s; 1H).

Die in der folgenden Tabelle genannten Amide wurden gemäß den vorstehenden Beispielen oder analog der zitierten Literatur erhalten:

45

40

50

	•								=	
5	-	(m;3H),					0 (q;2н),	16 (m;1H),	2,86 (m; 8,09 (s;1H)	
10	o in ppm)]	1,50 (s;9H), 7,00 (s;1H), 7,45 (m;3H), 7,65 (m;2H), 7,85 (s;1H)		52-65 1,48 (s;9H), 2,72 (s;3H), 7,25 (s;1H,NH), 7,91 (s;1H)	1,50 (s;9H), 7,40 (s;1H,NH), 7,40-7,90 (m;5H), 8,03 (s;1H)		1,36 (t;3H), 1,48 (s;9H), 2,80 (q;2H), 6,78 (s;1H, NH), 8,01 (s;1H)	50- 55 40- 43 1,36 (d;6H), 1,48 (s;9H), 3,06 (m;1H), 6,78 (s;1H,NH), 8,00 (s;1H)	0,58-0,96(m;4H), 1,34(d;6H), 1H), 3,08 (m;1H), (s;1H,NH),	
15	phys. Daten [Fp. (°C); NMR (0 in ppm)]	1,50 (s;9H), 7,00 (s;1H) 7,65 (m;2H), 7,85 (s;1H)		62-65 1,48 (s;9H), 2,72 (s;3H), 7,25 (s;1H,NH), 7,91 (s;1	, т, ч, ч, т, ч, т, ч, т, ч, т,	29 63 74	(t;3H), 1,4 (s;1H, NH),	55 43 (d;6H), 1, ((s;1H,NH),	.0,96(m;4H) 3,08 (m;1H	41 60 83 150
20	phys. Daten [Fp. (°C);	1,50 (64-67 223 83-88	62-65 1,48 7,25	1,50	126–129 60– 63 72– 74	1,36	50- 55 40- 43 1,36 (d 6,78 (s	0,58-0, 1H), 3,	36- 41 57- 60 80- 83 147-150
25	×	so.	ഗ ഗ ഗ	w w	w	u o c	. 0	000	0	0000
30			_	_					=	1 .
35	R4	tertButyl	tertButyl 4-Cl-Phenyl cvclo-Probyl	cyclo-Propyl tertButyl	tertButyl	tertButyl tertButyl	tertButyl	cyclo-Propyl 3-CF ₃ -Phenyl tertButyl	cyclo-Propy]	iso-Propyl iso-Propyl cyclo-Propyl 4-Cl-Phenyl
40	R 3	Ŧ	* * *	: = =	I	= = :	I I	r r r	I	 .
45	1	Phenylthio	Brom Phenyl	brom Methoxy Methyl	Phenyl	Methoxy Methyl	cyclo-Propyl Ethyl	Ethyl Ethyl iso-Propyl	iso-Propyl	iso-Propyl cyclo-Propyl cyclo-Propyl cyclo-Propyl
55	Nr. R1	2.3(a) P	_	2.6(a) 2.7(a) 2.8(a)	2.9(a)	2.10(b) 2.11(a)	2.12(a) 2.13(a)	2.14(a) 2.15(a) 2.16(a)	2.17(a)	2.18(a) 2.19(a) 2.20(a) 2.21(a)

55	50	45	40	35	30	25	20	15	10	5	
N.	R1		R 3	- -		*	phys. [Fp.	phys. Daten [Fp. (°C); NMR (& in ppm)]	(d in ppm)	1	_
2.22(a)	Pheny 1		I	tertButyl		.		93			
2.23(a)	Phenyl		I	iso-propyl	•	0		74			
2,24(a)	Pheny 1		I	cyclo-Propyl		0	-06	7 6			
2.25(a)	Pheny 1		I	3-CF ₃ -Pheny		0	127-129	59			
2.26(a)	Methyl		I	cyclo-Propyl	_	S	109-114	14			
2.27(a)	p-F-Benzyl	٨١	I	tertButyl		S	63-	· • • • • • • • • • • • • • • • • • • •			
2.28(a)	2.6-C1, C1-Benzyl	1-Benzyl	Ŧ	Cy anomethy l		S	82-85	82			
2.29(a)	tertButyl	tyl	×	tertButyl		s	85- 86	98			
2.30(a)	2-Pvridyl	۰	Ŧ	tertButyl		ν	93				
2.31(a)	3-CF ₃ -Benzyl	nzyl	Ŧ	tertButyl		S	97- 99	66			
2 32(a)	2-Phenyl-ethyl	-ethvl	I	Cyano-methy		S	100				
2.32(2)	4-C1-Phe	4-C1-Phenoxy-methyl	I	tertButyl		S	102				
2.35(a)	2 6-01.0	2 6-C1 C1-Benzv1	I	tertButyl		S	105-	105-106			
2.34(0)	Benzul		Ξ	tertButyl		s	1,48	1,48 (s;9H), 4,30			
7.35(4)	neuzy i		:				7, 15-	15-7,42 (m;6H),), 7,90 (s;1H)) (HI	
2.36(a)	2-Methoxy-ethyl	y-ethyl	I	tertButyl		S	1,48	(s;9H), (t;2H),	3,25 (t;2H), 7,25 (s;1H),	3,4 (s;3H), 7,95 (s;1H)	s;3H), (s;1H)
2.37(a)	2, 4-61, 6	2,4-Cl,Cl-Benzyl	I	tertButyl		S	1,48	18 (s;9H), 4,40 13-7,48 (m;4H),	40 (s;2H),), 7,92 (s;1H)	;1н)	
2.38(a)	2-Phenyl-ethyl	l-ethyl	I	tertButyl		S	1,48	1,48 (s;9H), 3,10 7,10-7,50 (m;6H),	10 (t;2H), 3,30 1), 7,90 (s;1H)	3,30 ;1H)	(t;2H)
2.39(a)	Methyl-1	Methyl-thiomethyl	I	tertButyl	_	w	. 1,48	(s;9H), (s;1H),	2,16 (s;3H), 8,00 (s;1H)		3,95 (s;2H)
2.40(a)	tertButyl	utyl	I	tertButyl	_	S	1,50	(s;9H), (s;1H)	3,86 (s;9н), 7,20 (s;1н)	7, 20	(s;1H)

5 10 15	phys. Daten [Fp. (°C); NMR (¢ in ppm)]	1, 49 (s;9H), 3,52 (s;3H), 4,7 (s; 2H), 7,10 (s;1H), 8,04 (s;1H)	1,48 (s;9H), 1,76 (d;2H), 4,43 (q; in), 7,15-7,43 (m;6H), 7,93 (s;1H)	88- 91 46- 50 1,00 (t;3H), 1,44 (s;9H), 1,81 (m; 2H), 2,74 (t;2H), 6,75 (bs;1H),NH), 8.05 (s;1H)	54-5/ 44-47 164-166 131-133 101-105 1,46 (s;9H), 3,50 (s;3H), 4,50 (s;2H), 6,80 (bs;1H,NH), 8,12 (s;1H) 83-87 78-80 132-134 0,60-0,90 (m;4H), 2,88 (m;1H), 3,44 (s;3H), 4,53 (s;2H), 6,94 (bs;1H,NH), 8,21 (s;1H)
25	×	S	S	000	o o o o o o o o o o o o
30		tertButyl	tertButyl	cyclo-Propyl tertButyl tertButyl	cyclo-Propyl 2,4-(CH ₃) ₂ -Phenyl cyclo-Propyl tertButyl iso-Propyl 4-Cl-Phenyl tertButyl cyclo-Propyl cyclo-Propyl cyclo-Propyl
35	4	tert	tert	cycl tert tert	cycl 2,4- 2,4- cycl iso 4-C 4-C ter ter cyc cyc
40	8	x	I	= = =	
4 5	R.1	Methoxymethyl	1-Phenyl-ethyl	cyclo-Hexyl cyclo-Hexyl n-Propyl	n-Propyl n-Propyl 4-Cl-Phenyl 4-Cl-Phenyl 4-Cl-Phenyl A-Cl-Phenyl tertButyl tertButyl tertButyl methoxymethyl
55	N.	2.41(a)	2.42(a)	2.43(a) 2.44(a) 2.45(a)	2.46(a) 2.47(a) 2.48(a) 2.49(a) 2.50(a) 2.51(a) 2.52(a) 2.52(a) 2.53(a) 2.54(a) 2.55(a)

3. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und Ib

Beispiel 1

5

4-Cyclopropylaminocarbonyl-2-isopropyl-oxazol-5-carbonsäure

Zu einer Lösung von 10,4 g (0,054 mol) 2-lsopropyl-oxazol-4-carbonsäurecyclopropylamid in 250 ml Tetrahydrofuran tropfte man unter Stickstoffatmosphäre bei -70 °C 0,12 mol n-Butyllithium (80,0 ml einer 1,5 molaren Lösung in Hexan) und rührte 30 min bei dieser Temperatur. Anschließend goß man das Reaktionsgemisch auf 500 g festes CO2 und ließ über Nacht stehen. Man engte ein, nahm den Rückstand in 200 ml Wasser und 30 ml 2N NaOH auf, extrahierte zweimal mit je 100 ml Diethylether, säuerte die wäßrige Phase mit konz. Salzsäure auf pH 2 an und extrahierte dreimal mit je 200 ml Ethylacetat. Man trocknete über Magnesiumsulfat und zog das Solvens im Vakuum ab.

Man erhielt 10,4 g (81 %) 4-Cyclopropylaminocarbonyl-2-isopropyl-oxazol-5-carbonsäure als weißes Pulver vom Smp. 109 bis 112 °C.

(Wirkstoffbeispiel 3.007).

Beispiel 2

25

4-tert.-Butylaminocarbonyl-2-methoxy-thiazol-5-carbonsäure

Zu einer Lösung von 8,00 g (37 mmol) 2-Methoxy-thiazol-4-carbonsäure-tert.-butylamid in 150 ml Tetrahydrofuran tropfte man bei -70° C 65 ml einer 1,5 m Lösung (97 mmol) von n-Butyllithium in n-Hexan und rührte 30 Minuten bei dieser Temperatur. Anschließend goß man das Reaktionsgemisch auf 500 g festes Kohlendioxid und ließ innerhalb von 14 Stunden auf Raumtemperatur erwärmen. Man entfernte das Lösungsmittel im Vakuum, nahm den Rückstand in einer Mischung aus 150 ml Wasser und 16 ml 2 m Natronlauge auf, filtrierte, säuerte das Filtrat mit konzentrierter Salzsäure an und saugte die ausgefallene Carbonsäure ab.

Man erhielt 7,80 g (82 %) 4-tert.-Butylaminocarbonyl-2-methoxythiazol-5-carbonsäure als weißes Pulver vom Fp.: 120 bis 122 °C. (Wirkstoffbeispiel 1.003).

Beispiel 3

45

5-tert.-Butylaminocarbonyl-2-methoxy-thiazol-4-carbonsäure

Zu einer Lösung von 5,4 g (25,2 mmol) 2-Methoxy-thiazol-4-carbonsäure-tert.-butylamid in 150 ml Tetrahydrofuran tropfte man unter Stickstoffatmosphäre bei -70 °C 56 mmol n-Butyllithium (37,3 ml einer 1,5 molaren Lösung in Hexan) und rührte 30 min bei dieser Temperatur. Anschließend goß man das Reaktionsgemisch auf 500 g festes CO₂ und ließ über Nacht stehen. Man engte ein, nahm den Rückstand in 150 ml Wasser und 10 ml 2N NaOH auf, extrahierte zweimal mit je 50 ml Diethylether, säuerte die wäßrige Phase mit konz. Salzsäure auf pH 2 an und extrahierte dreimal mit je 100 ml Ethylacetat. Man trocknete über Magnesiumsulfat und zog das Solvens im Vakuum ab.

Man erhielt 3,9 g (60 %) 5-tert.-Butylaminocarbonyl-2-methoxy-thiazol-4-carbonsäure als weißes Pulver vom Smp. 105 bis 110°C.

(Wirkstoffbeispiel 2.001)

Beispiel 4

a) 4-Ethoxycarbonyl-2-methyl-oxazol-5-carbonsäurechlorid

Zu 12,2 g (61,3 mmol) 4-Ethoxycarbonyl-2-methyl-oxazol-5-carbonsäure tropfte man bei 0°C 40 ml Thionylchlorid und 1 ml Dimethylformamid und erhitzte 1 h unter Rückfluß. Man zog das überschüssige Thionylchlorid im Vakuum ab und destillierte den Rückstand im Ölpumpenvakuum.

Man erhielt 10,9 g (82 %) 4-Ethoxycarbonyl-2-methyl-oxazol-5-carbonsäurechlorid als gelbes Öl vom Sdp. 103 bis 105 °C/0,1 Torr. 1 H-NMR (250 MHz, CDCl₃): δ = 1,42 (t; 3H), 2,66 (s; 3H), 4,66 (q; 2H).

o b) 4-Ethoxycarbonyl-2-methyl-oxazol-5-carbonsäure-tert.-butylamid

Zu 10,9 g (50,3 mmol) 4-Ethoxycarbonyl-2-methyl-oxazol-5-carbonsäurechlorid in 150 ml Dichlormethan tropfte man bei 0°C eine Lösung von 11,0 g (150 mmol) tert.-Butylamin in 20 ml Dichlormethan und rührte 12 h bei Raumtemperatur. Man nahm das Reaktionsgemisch in 200 ml Wasser auf, trennte die Phasen, wusch die organische Phase einmal mit gesättigter Natriumhydrogencarbonatlösung sowie gesättigter Natriumchloridlösung, trocknete über Magnesiumsulfat und zog das Solvens im Vakuum am Rotationsverdampfer ab.

Man erhielt 11,9 g (93 %) 4-Ethoxycarbonyl-2-methyl-oxazol-5-carbonsäure-tert.-butylamid als weißen Feststoff vom Smp. 152 bis 155 °C.

(Wirkstoffbeispiel 4.001).

Beispiel 5

25

35

50

5-tert.-Butylaminocarbonyl-2-methyl-oxazol-4-carbonsäure

Zu 7,4 g (29,1 mmol) 4-Ethoxycarbonyl-2-methyl-oxazol-5-carbonsäure-tert.-butylamid in 150 ml Ethanol und 50 ml THF tropfte man bei 0°C unter N₂ eine Lösung von 1,2 g (30,0 mmol) Natriumhydroxid in 50 ml Wasser. Man rührte 2 h bei 20°C, zog die Solventien am Rotationsverdampfer im Vakuum ab, nahm den Rückstand in 300 ml Wasser auf, stellte auf pH = 9 ein und extrahierte die wäßrige Phase dreimal mit je 100 ml Diethylether. Anschließend säuerte man mit 6N HCl auf pH = 2 an und extrahierte viermal mit je 150 ml Dichlormethan. Die organische Phase wurde über Natriumsulfat getrocknet und das Solvens im Vakuum abgezogen.

Man erhielt 6,1 g (93 %) 5-tert.-Butylaminocarbonyl-2-methyl-oxazol-4-carbonsäure als weißen Feststoff vom Smp. 186 bis 188° C. (Wirkstoffbeispiel 4.002).

40 Beispiel 6

a) 4-Ethoxycarbonyl-2-methylthio-thiazol-5-carbonsäurechlorid

3,40 g (13,7 mmol) 4-Ethoxycarbonyl-2-methylthio-thiazol-5-carbonsäure wurden in 50 ml Thionylchlorid gelöst und bis zur Beendigung der Gasentwicklung zum Rückfluß erhitzt. Man entfernte überschüssiges Thionylchlorid im Vakuum und behielt 3,55 g (98 %) Säurechlorid als farbloses Öl zurück.

1H-NMR (CDCl₃, 250 MHz, TMS als interner Standard): 1,50 (t, J=7,0 Hz; 3H), 2,75 (s; 3H), 4,60 (q, J=7,0 Hz; 2H).

b) 4-Ethoxycarbonyl-2-methylthio-thiazol-5-carbonsäure-tert.-butylamid

3,50 g (13,2 mmol) 4-Ethoxycarbonyl-2-methylthio-thiazol-5-carbonsäurechlorid wurden in 20 ml Dichlormethan gelöst und bei 0°C zu einer Lösung von 3,20 g (44 mmol) tert.-Butylamin in 50 ml Dichlormethan getropft. Man ließ das Gemisch auf Raumtemperatur erwärmen, rührte 14 Stunden nach und gab dann 100 ml 10 %ige Salzsäure zu. Die organische Phase wurde abgetrennt, mit 50 ml Wasser gewaschen und über Natriumsulfat getrocknet. Man entfernte das Lösungsmittel im Vakuum und behielt

4,00 g (100 %) Produkt als gelben Kristallbrei zurück. 1 H-NMR (CDCl₃, 250 MHz, TMS als interner Standard): 1,45 (t, J=7,0 Hz; 3H), 1,45 (s; 9H), 2,75 (s; 3H), 4,50 (q, J=7,0 Hz; 2H), 9,90 (s, breit; 1H). (Wirkstoffbeispiel 2.007)

Beispiel 7

5

5-tert.-Butylaminocarbonyl-2-methylthio-thiazol-4-carbonsäure

4,00 g (13,2 mmol) 4-Ethoxycarbonyl-2-methylthio-thiazol-5-carbonsäure-tert.-butylamid wurden in 50 ml Wasser/Ethanol (2:1) gelöst, mit 0,82 g (14,6 mmol) Kaliumhydroxid in 10 ml Wasser versetzt und zwei Stunden zum Rückfluß erhitzt. Anschließend entfernte man das Lösungsmittelgemisch im Vakuum, nahm den Rückstand mit 50 ml Wasser auf und säuerte mit konzentrierter Salzsäure an. Das ausgefallene Produkt wurde abgesaugt und getrocknet.

Ausbeute: 3,40 g (94 %); Schmelzpunkt: 100 °C. (Wirkstoffbeispiel 2.005).

20 Beispiel 8

4-tert.-Butylaminocarbonyl-2-methoxy-thiazol-5-carbonsäure-acetonoximester

Zu einer Lösung von 3,1 g (12,0 mmol) 4-tert.-Butylaminocarbonyl-2-methoxy-thiazol-5-carbonsäure und 1,2 g (16,4 mmol) Acetonoxim in 100 ml Dichlormethan tropfte man bei Raumtemperatur 4,4 g (43,6 mmol) 4-Methylmorpholin sowie 1,5 g (12,3 mmol) 4-Dimethylaminopyridin und rührte 5 min. Anschließend fügte man 10,1 g einer 50 %igen Lösung von Propanphosphonsäureanhydrid in Dichlormethan (= 15,9 mmol) zu und erhitzte 7 h unter Rückfluß. Man engte ein, nahm den Rückstand in 100 ml Ethylacetat auf, extrahierte zweimal mit gesättigter Nariumhydrogencarbonatlösung sowie je einmal mit 5 %iger Zitronensäurelösung, gesättigter Natriumcarbonatlösung und gesättigter Natriumchloridlösung. Die organische Phase wurde über Magnesiumsulfat getrocknet und das Solvens im Vakuum abgezogen.

Man erhielt 3,1 g (82 %) 4-tert.-Butylaminocarbonyl-2-methoxy-thiazol-5-carbonsäure-acetonoximester

als weißes Pulver vom Smp. 128 bis 131°C. (Wirkstoffbeispiel 1.011).

35

Beispiel 9

5-tert.-Butylaminocarbonyl-2-methyl-oxazol-4-carbonsäure-acetonoximester

Zu einer Lösung von 3,80 g (16,8 mmol) 5-tert.-Butylamino-carbonyl-2-methyl-oxazol-4-carbonsäure und 1,23 g (16,8 mmol) Acetonoxim in 40 ml Tetrahydrofuran tropfte man bei Raumtemperatur 3,46 g (16,8 mmol) Dicyclohexylcarbodiimid in 20 ml Tetrahydrofuran. Man rührte 14 h, saugte den ausgefallenen Niederschlag ab, zog das Solvens im Vakuum ab und chromatographierte den Rückstand an Kieselgel (Lösungsmittel: Cyclohexan:Ethylacetat (1:1)). Man erhielt 2,7 g (57 %) 5-tert.-Butylaminocarbonyl-2-methyloxazol-4-carbonsäure-acetonoximester als weißen Feststoff vom Smp. 107 bis 111 °C. (Wirkstoffbeispiel 4.003).

Die in den folgenden Tabellen aufgeführten Wirkstoffe wurden analog zu den voranstehenden Verbindungen hergestellt.

5	_	ppm)]	(m; 3H), (s; 1H), (d; 2H), (s; 1H),
10		NMR (6 in	7,55 7,90 7,50 8,85
15		phys. Daten [Fp. (°C); NMR (& in ppm)]	141-144 138-142 120-122 146-148 194-195 1, 50 (s; 9H), 7, 75 (m, 2H), 16.60 (s; 1H) 1, 50 (s; 9H), 7, 65 (d, 2H), 16, 50 (s; 1H) 11, 50 (s; 1H) 11, 50 (s; 1H) 128-131 128-131
20		>	
25	£ 754	25	H H H H H -N=C(CH ₃) ₂ -N=C(CH ₃) ₂ -N=C(CH ₃) ₂
30		R 4	tertButyl cyclo-Propyl tertButyl tertButyl tertButyl tertButyl tertButyl tertButyl tertButyl tertButyl
35	ж 1	~	
40		R3	т н н н н н н н н н н н н н н н н н н н
45		R I	Methyl Methoxy Methoxy Phenyl Phenylthio 4-Cl-Phenylthio Methyl Methyl
50		Beispiel Nr.	1.001 1.002 1.003 1.004 1.005 1.006 1.009 1.009 1.010

5		ppm)]	(m; 2H), (s; 3H), (m; 1H),																	
10		Daten (°C); NMR (ð in ppm)]	2H), 0,89 (n 3H), 2,12 (s 3H), 2,94 (n 1H)																	
15	0	phys. Daten [Fp. (°C);	= 0 0 0	143-146	71	26	93	76	100	100-102	109-110	128	132	142	148-150	•	150-153	158-161	162-164	
20		>	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	•	o	0	0	
25		R5	-N=C (CH3) 2	-N=C (CH3) 2	I	I	I	I	I	I	I	I	I	I	I		I	I	I	
30			cyclo-Propyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl		tertButyl	tertButyl	tertButyl	
35		R 4	cycl	ter	ter	ter	ter	ter	ter	ter	ter	ter	ter	ter	ter		ter	ter	ter	
40		R3	I	x	I	I	I	=	±	. H lkzus	Ŧ	I	I	I	I		Ŧ	henyl H	=	
45	Tabelle l (Fortsetzung)	R1	Methyl	Phenyl	n-Butyl-S-	iso-Propyl-S-	4-F-Benzyl	2-Phenyl-ethyl	Methoxy-methyl	2, 4-C1, C1-Benz	3-CF ₃ -Benzyl	Benzyl	tertButyl	cvclo-Propyl	4-C1-Phenoxy-	methyl	iso-Propyl	Q	3, 4, 5-Trimeth-	oxy-benzyl
50	Tabelle 1	Beispiel Nr.	1.012	1.013	1.014	1.015	1.016	1.017	1.018	1.019	1.020	1.021	1.022	1.023	1.024		1.025	1.026	1.027	

5		-							(ф;1Н),		-7,45 (m;3H)	
10					[Fp. (°C); NMR (8 in ppm)]				1,51 (s,9H), 1,78 (d;2H), 4,40 (q;1H),	/,16-/,45 (m;5H), 8,00 (S;1H), 16-80 (S:1H)	(s;2H), 7,25	7,95 (s;1H), 16-70 (s;1H)
15		٠		Jaten	C); NMR (;9H), 1,78	t5 (M;5H), 5:1H)	;9H), 4,61	;1н), 16-7
20				nhvs. Daten	[Fp. (°	201	199	147	1,51 (5,	(m) C+''-91'/ 16-80 (S:1H)	1, 50 (s)	7,95 (s
25				>		0	0	0	0		0	
30				50		· I	Na Na	Ŧ	I		I	
35	• .			70		tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl		tertButyl	•
40				0		Ξ	I	I	I		I	
45			ortsetzung)			2-Pyridyl	4-F-Benzyl		1-Phenyl-ethyl		2,6-cl,cl-Benzyl	
50 55		:	Tabelle 1 (Fortsetzung)		Nr.	1.028 2					1.032	
55			-		2		_	-	_		_	•

55	rabelle 2	·	Beispiel Nr.	2.001	. 2.002	2.003	2.004	2.005	2.006	2.007		2.008	5.009		2.010	2.011	2.012		2.013	2.014
4 5			R1	Methoxy	Phenyl	Phenyl	Pheny 1	Methylthio	4-Cl-Phenylthio	SCH ₃		n-Butyl-S-	iso-Propyl-S-		cyclo-Propyl	iso-Propyl	3,4,5-Trimeth-	oxy-benzyl	Methoxy-methyl	tertButyl
40			R3	×	I	I	I	Ŧ	I	, =		I	I		I	±	I		I	I
35			7. A.	tertButy	tertButyl	4-C1-Phenyl	4-Cl-Phenyl	tertButyl	tertButy	tertButyl		tertButy	tertButyl		tertButyl	tertButy	tertButy		tertButyl	tertButyl
30		~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~	z S	Ŧ	±	l Methyl	±	H 1	I	l Ethyl		±	II -		H .	H	Н		. H	II -
25			>	0	0	0	0	0	0	0		0	0		0	0	0		0	0
20			phys. Daten [Fp. (°C);	105-110	120	136	167	100	75-77	1,45 (t,3H)	9,9 (s, 1H)	81	1, 45 (s, 9H)	10,0 (s, 1H)	84	105-106	115		120-121	143
10		,	Daten (°C); NMR (8 in ppm)]							1,45 (t,3H); 2,75 (s,3H); 4,5 (q,2H),			1,45 (s,9H); 1,50 (d,6H); 3,80 ("sept.",1H)							
5		-								`		,	pt.", 1H]							

5	-		152-156 0,95-1,08 (m,;2H), 1,15-1,28 (m;2H), 1,45 (t;3H), 1,45 (s;9H), 2,28-2,42 (m;1H), 4,45 (q;2H), 9,92 (s;1H)	1,45 (s;9H), 3,55 (s;3H), 4,75 (s;2H), 9,18-9,65 (s;1H), 9,98 (s;1H),	1,42 (t;3H), 1,45 (s;9H), 3,50 (s;3H), 4,50 (q;2H), 4,75 (s;2H), 9,95 (s;1H)	6,95-7,15 (m;2H), ;1H)
10		(ø in ppm)]	4), 1,15-1, 45 (s;9H), 92 (s;1H)	55 (s;3H),), 9,98 (s;	45 (s;9H), 75 (s;2H),	30 (s;2H),), 9,95 (s;
15		phys. Daten [Fp. (°C); NMR (& in ppm)]	152-156 0,95-1,08 (m,;2H), 1,15-1,28 (m;2H), 1,45 (t;3H), 1,45 (s;9H), 2,28-2,42 4,45 (q;2H), 9,92 (s;1H)	1,45 (s;9H), 3,55 (s;3H), 4,75 9,18-9,65 (s;1H), 9,98 (s;1H),	(t;3H), 1, (q;2H), 4,	1,45 (s;9H), 4,30 (s;2H), 6,9° 7,20-7,35 (m;2H), 9,95 (s;1H)
20		phys. [Fp.	152-156 0,95-1,(1,45 (t 4,45 (q	1,45	1,42	1,45
· 25		>	0 0	0	0	0
30		R5	Ethyl Ethyl	x	Ethyl	I
35		R4	tertButyl tertButyl	tertButyl	tertButyl	tertButyl
40		R 3	* *	I	x	I
45	Tabelle 2 (Fortsetzung)	12	Benzyl cyclo-Propyl	Methoxy-methyl	Methoxy-methyl	4-F-Benzyl
55	Tabelle 2	Beispiel	2.015	2.017	2.018	2.019

5		_									•										
10			ohys. Daten [Fp. (°C); NMR (ø in ppm)]								•										
15			phys. Daten [Fp. (°C); NMR	152-157	130-131	.35–138	169-172		151-153	109-112	64-70	-109	87-90	118-120	121-125	62-65	62-92	101-104	48-151	03-106	126-129
20			phy [Fp	152	130	135	169	117	151	109	-49	107	- 83	118	121	-62	-9/	10	148	10	12(
			>	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
25												-N=C (CH3) 2	-N=C(CH ₃) ₂	-N=C(CH ₃) ₂	-N=C(CH3)2	-N=C(CH ₃) ₂	-N=C (CH3) 2	-N=C(CH ₃) ₂		-N=C (CH3) 2	
30		ጽ ጽሑ ይ ፋቪ	R.S.	I	I	I	I	I	I	I	I	7	7	7	7	Ī	ī	ī	I	ī	I
35		Z=\ Z=\ Z=\	R4	tertButyl	tertButyl	cyclo-Propyl	3-CF ₃ -Phenyl	tertButyl	tertButyl	cyclo-Propyl	iso-Propyl	tertButyl	cyclo-Propyl	3-CF ₃ -Phenyl	tertButyl	cyclo-Propyl	iso-propyl	tertButyl	iso-Propyl	iso-Propyl	cyclo-Propyl
40			R3	I	I	I	I	I	I	I	I	I	I	I	I	I	I	I	I	I	I
4 5			12 1	Methyl	Ethyl	Ethyl	Ethyl	cyclo-Propyl	iso-Propyl	iso-Propyl	iso-Propyl	Ethyl	Ethyl	Ethyl	iso-Propyl	iso-Propyl	i so-Propvl	cvclo-Propyl	cvclo-Propvl	cyclo-Propyl	cyclo-Propyl
55	Tabelle 3		Beispiel Nr.	3,001	3 002	3.003	3.004	3.005	3,006	3.007	3.008	3.009	3.010	3.011	3 012	3.013	3.016	3 015	3.016	3.017	3.018

55	50	45	40	35	25 30	-	20	15	10		5
Tabelle 3	Tabelle 3 (Fortsetzung)	ig)									
Beispiel Nr.	R1		R 3	R4	R5	>	phys. Daten [Fp. (°C); NMR (0 in ppm)]	IMR (6	in ppm)]		- 1
010	[voorb-of-vo	[2	-	cvclo-Propvl	-N=C(CH ₃),	0	108-110				
3 020	cyclo ropy		: I	4-C1-Phenyl		0	213-215				
3.021	Ethyl		· =	iso-Propyl	I	0	103-106				
3.022	Ethyl		I	iso-Propyl	-N=C (CH ₃) ₂	0	93-95				
3.023	Ethyl		I	tertButyl	-N=C(cyclo-	0	107-110				
	•				Propyl) ₂						
3.024	iso-Propyl	لعم	I	tertButyl	CH ₂ -C≡CH	0	1,42 (d;6H),		1,44 (s;9H), 2,61 (t;1H),	, 61 (t;1H),
							3,18 (m;1H),		(d;2H), 8	, 46	(DS;1H,NH)
3.025	Pheny 1		I	tertButyl	I	0	203-206				
3.026	Pheny 1		Ŧ	iso-Propyl	Ŧ	0	144-146				
3.027	Pheny 1		I	cyclo-Propyl	I	0	217-218				
3.028	iso-Propy!		=	tertButyl	4-CH ₃ 0-Phenyl	0	137-139				
3.029	cyclo-Propyl	pyl	I	4-Cl-Phenyl	-N=C (CH ₃) ₂	0	126-128				
3.030	Phenyl		I	tertButyl	-N=C (CH3) 2	0	149-154				
3.031	Phenyl		Ŧ	cyclo-Propyl	-N=C (CH ₃) ₂	0	160-164				
3.032	cyclo-Hexyl	yl	I	tertButyl	-N=C(CH ₃) ₂	0	121-125				
3.033	cyclo-Hexy	yl	I	cyclo-Propyl	I	0	117-119				
3.034	cyclo-Hexy	yl	I	cyclo-Propyl	-N=C (CH ₃) ₂	0	119-122				
3.035	Phenyl		I	iso-Propyl	-N=C (CH ₃) ₂	0	137-139				
3.036	n-Propyl		I	tertButyl		0	108-110				
3.037	n-Propyl		×	tertButyl	-N=C (CH3) 2	0	69-72				
3.038	n-Propyl		I	cyclo-Propyl	I	0	120-123				
3,039	n-Propyl		I	$2, 4-(CH_3)_{2}$	I	0	142-145				
				Pheny l							

5	-							•				
			m)]									
10			phys. Daten [Fp. (°C); NMR (ð in ppm)]									
			NMR (c									
15			phys. Daten [Fp. (°C); N	109	176-178	132-134	114-118		125-128	123-126	124-127	
20	•		phys [Fp.	104-109	176-	132-	114-		125-	123-	124-	
·			>	0	0	0	0		0	0	0	
25 .				٠					3H3)2	CH3) 2	CH3) 2	
30			R5	I	=	I	I		-N=C (CH3)	-N=C(CH3)2	-N=C(CH ₃) ₂	
30				ty 1	tyl	opyl		ropyl	tyl	opyl		ropyl
35				rtBu	tertButyl	cyclo-Propyl	-сн-сн ₃	cyclo-Propyl	tertButyl	cyclo-Propyl	-сн-сн	l cyclo-Propyl
			R.	te	te	Сy	٠ -	J	te	ςς	۲	_ 0
40			R3	=	I	I	I		I	I	Ξ	
45		(bun		ethyl	tyl,	ty1	ıtyl		ıtvı	ıtyı	ıtyl	
		rtsetz		Methoxymethy	tertButyl	tertButyl	tertButyl		tertButyl	tertButyl	tertButyl	
50		Tabelle 3 (Fortsetzung)	I R1	Æ	, t	te	te		te	<u>נ</u>	ţ	
		abelle	Beispiel Nr.	070 €	3.041	3.042	3.043		770 E	3.045	3.046	
55		-	8 21									

5		in ppm)]		
10		NMR (6		
15		phys. Daten [Fp. (°C); NMR (& in ppm)]	152-155 186-188 107-111 155-166	230-232.
20		>	0000	0
25	R R 3 3 3 4 4 .	RS	Ethyl H -N=C(CH ₃) ₂ Ethyl	I
30	2=0		tertButyl tertButyl tertButyl tertButyl	tertButyl
35	.	8	ַר נָר נָר נָר נָר נָר נָר נָר נְרָ נְרָ	Ţ
40		R 3	* * * *	I
45		R1	Methyl Methyl Methyl Phenyl	Pheny 1
50	Tabelle 4	Beispiel Nr.	4.001 4.002 4.003	4.005

Anwendungsbeispiele

Die herbizide Wirkung der Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide der Formeln la und lb ließ sich durch Gewächshausversuche zeigen:

Als Kulturgefäße dienten Plastikblumentöpfe mit lehmigem Sand mit etwa 3,0 % Humus als Substrat. Die Samen der Testpflanzen wurden nach Arten getrennt eingesät.

Bei Vorauflaufbehandlung wurden die in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffe direkt nach Einsaat mittels fein verteilender Düsen aufgebracht. Die Gefäße wurden leicht beregnet, um Keimung und Wachstum zu fördem und anschließend mit durchsichtigen Plastikhauben abgedeckt, bis die Pflanzen angewachsen waren. Diese Abdeckung bewirkt ein gleichmäßiges Keimen der Testpflanzen, sofern dies nicht durch die Wirkstoffe beeinträchtigt wurde.

Zum Zwecke der Nachauflaufbehandlung wurden die Testpflanzen je nach Wuchsform erst bei einer Wuchshöhe von 3 bis 15 cm mit den in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffen behandelt. Die Aufwandmenge für die Nachauflaufbehandlung betrug 1,0 kg/ha a.S.

Die Pflanzen wurden artenspezifisch bei Temperaturen von 10-25 °C bzw. 20-35 °C gehalten. Die Versuchsperiode erstreckte sich über 2 bis 4 Wochen. Während dieser Zeit wurden die Pflanzen gepflegt und ihre Reaktion auf die einzelnen Behandlungen wurde ausgewertet.

Bewertet wurde nach einer Skala von 0 bis 100. Dabei bedeutet 100 kein Aufgang der Pflanzen bzw. völlige Zerstörung zumindest der oberirdischen Teile und 0 keine Schädigung oder normaler Wachstumsverlauf.

Die in den Gewächshausversuchen verwendeten Pflanzen setzten sich aus folgenden Arten zusammen:

Lateinischer Name	Deutscher Name
Cassia tora Chenopodium album Chrysanthemum coronarium Ipomoea spp. Triticum aestivum Veronica spp.	Gumüse-Kassie Weißer Gänsefuß Kronenwucherblume Prunkwindearten Sommerweizen Ehrenpreisarten

30

35

10

20

25

Mit 1,0 kg/ha a.S. im Nachauflaufverfahren eingesetzt, lassen sich mit den Beispielen 1.001, 1.003, 1.004, 1.009, 1.010, 1.011, 3,002, 3,005 und 3,024 breitblättrige unerwünschte Pflanzen sehr gut bekämpfen. Verbindungen 1.001, 1.003 und 1.009 zeigen gleichzeitig Kulturpflanzenverträglichkeit an Weizen. Verbindung 3.005 wird sehr gut von der Kulturpflanze Mais toleriert.

Ansprüche

1. Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamide der Formeln la und lb

45

in denen die Substituenten folgende Bedeutung haben:

X Sauerstoff oder Schwefel;

R¹ Wasserstoff; Halogen; C¹-C6-Alkyl, welches ein bis fünf Halogenatome und/oder einen oder zwei der folgenden Reste tragen kann: C₃-C6-Cycloalkyl, C¹-C4-Alkoxy, C¹-C4-Halogenalkoxy, C¹-C4-Alkylthio, C¹-C4-Halogenalkylthio oder Cyano;

Benzyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkylthio, C₁

C₃-C₈-Cycloalkyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: C₁-C₄-Alkyl oder Halogen; C₂-C₆-Alkenyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen, C₁-C₃-Alkoxy und/oder ein Phenyl, das seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro;

- C₂-C₅-Alkinyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen oder C₁-C₃-Alkoxy und/oder ein Phenyl, das seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro:
- C₁-C₄-Alkoxy; C₁-C₄-Alkylthio; C₁-C₄-Halogenalkoxy; C₁-C₄-Halogenalkylthio; Phenoxy oder Phenylthio, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Halogen, Cyano oder Nitro;
- ein 5- bis 6-gliedriger heterocyclischer Rest, enthaltend ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt aus der 10 Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff, wobei der Ring eln oder zwei der folgenden Reste tragen kann: C₁-C₃-Alkyl, Halogen, C₁-C₃-Alkoxy oder C₁-C₃-Alkoxycarbonyl;
 - Phenyl, welches eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, Halogen, Nitro und Cyano, R² Formyl, 4,5-Dihydrooxazol-2-yl oder den Rest -COYR⁵;
- 15 Y Sauerstoff oder Schwefel;
 - R5 Wasserstoff;
 - C_1 - C_6 -Alkyl, welches ein bis fünf Halogenatome oder Hydroxygruppen und/oder einen der folgenden Reste tragen kann: C_1 - C_4 -Alkoxy, C_2 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkoxy, Cyano, Trimethylsilyl, C_1 - C_3 -Alkylthio, C_1 - C_3 -Alkylamino, C_1 - C_3 -Dialkylamino, C_3 - C_7 -Cycloalkylamino, C_1 - C_3 -Alkylsulfinyl, C_1 - C_3 -Alkylsulfonyl, Carboxyl, C_1 - C_3 -Alkylsulfonyl, C_1 - C_3 - C_1 - C_3 - C_1 - C_2 - C_3 - C_1 - C_3 - C_1 - C_3 - C_1 - C_2 - C_1 - C_2 - C_3 - C_1 - C_3 - C_1 - C_2 - C_1 - C_1 - C_2 - C_1 - C_1 - C_2 - C_1 - C_1 - C_1 - C_1 - C_2 - C_1 - C_1
- 20 C₃-Alkoxycarbonyl, C₁-C₃-Dialkylaminocarbonyl, C₁-C₃-Dialkoxyphosphonyl, Alkaniminoxy, Thienyl, Furyl, Tetrahydrofuryl, Phthalimido, Pyridyl, Benzyloxy, Benzoyl, wobei die cyclischen Reste ihrerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen können: C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy oder Halogen;
 - Benzyl, das eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy, C₁-C₃-Halogenal-kyl, Halogen, Nitro und Cyano;
- 25 C₃-C₈-Cycloalkyl;
 - Phenyl, das eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl, Halogen, Nitro und Cyano;
 - C_3 - C_8 -Alkenyl, C_5 - C_6 -Cycloalkenyl oder C_3 - C_8 -Alkinyl, wobei diese Reste eine der folgenden Gruppen tragen können: Hydroxy, C_1 - C_4 -Alkoxy, Halogen oder einen Phenylring, welcher seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, Halogen, Nitro und
 - Cyano; einen fünf- bis sechsgliedrigen heterocyclischen Rest enthaltend ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff oder einen Benzotriazolrest;
 - Phthalimido; Tetrahydrophthalimido; Succinimido; Maleinimido;
- ein Äquivalent eines Kations aus der Gruppe der Alkali- oder Erdalkalimetalle, Mangan, Kupfer, Eisen, Ammonium und substituiertes Ammonium;
 - einen Rest -N = CR6R7;
 - R^6 , R^7 Wasserstoff; C_1 - C_4 -Alkyl; C_3 - C_6 -Cycloalkyl; Phenyl oder Furyl oder zusammen eine Methylenkette der Formel - $(CH_2)_m$ mit m = 4 bis 7 Kettengliedern;
- 40 R³ Wasserstoff; C¹-C₆-Alkyl, das einen bis drei der folgenden Substituenten tragen kann: Hydroxy, Halogen, C¹-C₄-Alkoxy, C¹-C₄-Alkylthio oder Di-C¹-C₃-Alkylamino;
 - C₃-C₈-Cycloalkyl, welches ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: C₁-C₄-Alkyl, Halogen und C₁-C₄-Halogenalkyl;
 - R⁴ Hydroxy; C₁-C₄-Alkoxy;
- C₁-C₅-Alkyl, das eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Dialkylamino, Halogen, C₃-C₈-Cycloalkyl oder Phenyl, welches seinerseits ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio oder C₁-C₄-Halogenalkylthio;
 - C₃-C₈-Cycloalkyl, das eine bis drei der folgenden Grupen tragen kann: C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₅-Halogenalkyl,
- 50 C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Halogen, Nitro oder Cyano; C₃-C₆-Alkenyl oder C₃-C₆-Alkinyl, das ein- bis dreimal durch Halogen und/oder einmal durch Phenyl substituiert sein kann, wobei der Phenylring seinerseits eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylt-
- hio, Halogen, Cyano oder Nitro; ein 5- bis 6-gliedriger heterocyclischer Rest enthaltend ein oder zwei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel oder Stickstoff, welcher ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: C₁-C₄-Alkyl oder Halogen;
 - Phenyl, das eine bis vier der folgenden Gruppen tragen kann: C₁-C₄-Aikyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-

Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Halogen, Nitro, Cyano, Formyl, C₁-C₄-Alkonyl, C₁-C₄-Halogenalkanoyl oder C₁-C₄-Alkoxycarbonyl;

Naphthyl, das ein- bis dreimal durch C1-C4-Alkyl oder Halogen substituiert sein kann,

R³ und R⁴ gemeinsam einen Rest der Struktur -(CH₂)_n-Y_p-(CH₂)_q-, wobei n und q 1, 2 oder 3, p 0 oder 1 und Y Sauerstoff, Schwefel oder N-Methyl bedeuten oder den Rest der Formel -(CH₂)₃-CO-bilden, sowie deren umweltverträgliche Salze,

wobei in der Formel Ib X nicht Schwefel bedeutet, wenn R¹ 3-Pyridyl, R² CO₂CH₂CH₃ oder R³ Wasserstoff bedeutet, und wobei in der Formel Ia X nicht Schwefel oder R¹ nicht Thien-2-yl bedeutet, wenn YR⁵ für OH steht und R³ Wasserstoff und R⁴ Methyl bedeutet.

2. Oxazol- oder Thiazolcarbonsäureamide der Formeln la und Ib nach Anspruch 1, in denen R³ Wasserstoff bedeutet.

3. Oxazol- oder Thiazolcarbonsäureamide der Formeln la und Ib nach Anspruch 1, in denen die Substituenten folgende Bedeutung haben:

R1 Wasserstoff; C1-C4-Alkyl; C1-C4-Alkoxy; C1-C4-Halogenalkoxy; C1-C4-Alkylthio oder C1-C4-Halogenalkylthio;

R² einen Rest -COYR⁵;

R⁵ Wasserstoff; Phthalimido; Succinimido; Maleinimido oder ein Rest -N = R⁶R⁷

 R^6 , R^7 Wasserstoff; C_1 - C_4 -Alkyl und C_3 - C_6 -Cycloalkyl oder zusammen eine Methylenkette der Formel -- $(CH_2)_m$ - mit m = 4 bis 7 Kettengliedern,

R3 Wasserstoff und

25

30

35

40

50

R⁴ C₁-C₄-Alkyl oder C₃-C₈-Cycloalkyl.

4. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und Ib gemäß Anspruch 1, in denen R^2 CO_2R^5 und R^5 C_1 - C_6 -Alkyl bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man einen Diester der Formel II

R1 X OR5

ΙI

in an sich bekannter Weise mit einem Äquivalent einer wäßrigen Base zu einem Gemisch der Monoester Illa und Illb

IIIa

R1 X OH

IIIb

hydrolysiert und IIIa und IIIb danach getrennt oder im Gemisch zunächst in das Halogenid oder eine andere aktivierte Form der Carbonsäure überführt und diese Derivate anschließend mit einem Amin der Formel IV

HN R4

I۷

amidiert.

5. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und Ib gemäß Anspruch 1, in denen X Schwefel und R² CO₂H bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Dicarbonsäureanhydrid der Formel V

5

15

in an sich bekannter Weise mit einem Amin der Formel IV gemäß Anspruch 4 zu den Isomeren la und Ib umsetzt und anschließend das Gemisch in die Isomeren auftrennt.

6. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und Ib gemäß Anspruch 1, in denen R¹ nicht Halogen und R² Carboxyl oder Formyl bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man eine Carbonsäure der Formel Illc bzw. Illd

in an sich bekannter Weise zunächst gemäß Anspruch 4 aktiviert und amidiert und das so erhaltene Amid VIa bzw. VIb

- anschließend in Gegenwart einer Base mit einem Carboxylierungs- oder einem Formylierungsreagens umsetzt.
 - 7. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und Ib gemäß Anspruch 1, in denen R^2 CO_2H bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Carbonsäureamid la bzw. Ib in dem R^2 CO_2R^5 und R^5 C_1 - C_6 -Alkyl bedeutet in an sich bekannter Weise mit einem Äquivalent einer wäßrigen Base hydrolysiert.
 - 8. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und lb, in denen R² COYR⁵ bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man eine entsprechende Carbonsäure la bzw. lb (R² = CO₂H) gemäß Anspruch 4 aktiviert und anschließend in an sich bekannter Weise mit einer Verbindung VII HYR⁵ VII
 - umsetzt. 9. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen la und lb, in denen R^2 4,5-Dihydrooxazol-2-yl bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man eine entsprechende Carbonsäure la bzw. lb ($R^2 = CO_2H$, CO_2R ; $R^{'} = C_1-C_4$ -Alkyl) in an sich bekannter Weise mit 2-Aminoethanol VIII

umsetzt. 10. Herbizides Mittel, enthaltend neben inerten Zusatzstoffen mindestens ein Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamid der Formel la bzw. Ib

in der die Substituenten die in Anspruch 1 gegebene Bedeutung haben, und X Schwefel bedeuten kann, wenn R¹ 3-Pyridyl, R² CO₂CH₂CH₃ und R³ Wasserstoff bedeutet, oder wenn R¹ Thien-2-yl, YR⁵ Hydroxy, R³ Wasserstoff und R⁴ Methyl bedeutet.

- 11. Herbizides Mittel nach Anspruch 10, enthaltend neben mindestens einem Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamid der Formel la bzw. Ib und inerten Zusatzstoffen weitere wirksame Bestandteile.
- 12. Verfahren zur Bekämpfung unerwünschten Pflanzenwuchses, dadurch gekennzeichnet, daß man die unerwünschten Pflanzen und/oder die von unerwünschten Pflanzenwuchs freizuhaltende Fläche mit einer herbizid wirksamen Menge eines Oxazol- bzw. Thiazolcarbonsäureamids der Formel la bzw. Ib behandelt.